

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA
FACULTAD DE CIENCIAS QUÍMICAS Y FARMACIA



**“IMPLEMENTACIÓN DEL VADEMÉCUM DE MEDICAMENTOS
NOMBRADOS POR DENOMINACIÓN COMÚN INTERNACIONAL EN
GUATEMALA FASE III COMPRENDIENDO LOS MEDICAMENTOS DE LA
LETRA N A LA Z”**

Pablo Rubén Reyes Bravo


Byron Raúl Mazariegos Chávez

Sergio Iván Vásquez Luna

Químicos Farmacéuticos

Guatemala, Mayo de 2013

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA
FACULTAD DE CIENCIAS QUÍMICAS Y FARMACIA

The seal of the University of San Carlos of Guatemala is a circular emblem. It features a central figure, likely a saint or religious figure, surrounded by various symbols and text. The outer ring of the seal contains the Latin motto: "LETTERAS ORBIS CONSPICUA CAROLINA ACADEMIA COACTEMALENSIS INTER".

**“IMPLEMENTACIÓN DEL VADEMÉCUM DE MEDICAMENTOS
NOMBRADOS POR DENOMINACIÓN COMÚN INTERNACIONAL EN
GUATEMALA FASE III COMPRENDIENDO LOS MEDICAMENTOS DE LA
LETRA N A LA Z”**

Seminario de Investigación

Presentado por:

Pablo Rubén Reyes Bravo

Byron Raúl Mazariegos Chávez

Sergio Iván Vásquez Luna

Para Optar al título de:

Químicos Farmacéuticos

Guatemala, Mayo de 2013

JUNTA DIRECTIVA

Oscar C3bar Pinto, Ph.D.	Decano
Lic. Pablo Ernesto Oliva Soto, M.A.	Secretario
Licda. Liliana Vides de Urizar	Vocal I
Dr. Sergio Alejandro Melgar Valladares	Vocal II
Lic. Luis Antonio G3lvez Sanchinelli	Vocal III
Br. Fayver Manuel de Le3n Mayorga	Vocal IV
Br. Maily Graciela C3rdova Aud3n	Vocal V

POR PABLO RUBÉN REYES BRAVO

ACTO QUE DEDICO

A DIOS Y LA VIRGEN MARÍA:

Porque gracias a ellos he llegado a este momento y siempre me han acompañado en todo momento de mi vida, cuidándome y llenándome de muchas bendiciones.

A SAN JUAN BOSCO

Por guiarme y enseñarme la importancia de la humildad y trabajar con mucho esfuerzo y disciplina.

A MIS PADRES:

Rubén Reyes y María Teresa Bravo por el apoyo que me han brindado a lo largo de toda mi vida y sobre todo en esta etapa universitaria, por siempre saberme aconsejar y guiar con su ejemplo y sobre todo por su inmenso amor.

A MI HERMANA:

Stefany Reyes por su apoyo y cariño, por estar siempre presente cuando la he necesitado.

A MI NOVIA:

Carol Gallardo por su amor y por alentarme en todo momento a seguir adelante, por motivarme con sus consejos y brindarme su incondicional apoyo.

A MI FAMILIA:

A mis abuelitos Armando Bravo (+) y Bernabé Reyes (+) porque sé que desde el cielo están orgullosos y comparten conmigo este logro, a mis abuelitas Elizabeth Koppel y Olga Corzo por sus consejos y el cariño que siempre me han entregado, a mis tíos y primos que siempre han estado conmigo y apoyado en todo momento.

A MIS AMIGOS:

A mis amigos de infancia Diego, Carlos y Gerardo por su apoyo y amistad, a mis amigos y compañeros del colegio, universidad, EDC Hospitalario y EPS en LAPROMED en especial a mis amigos de formula Byron y Sergio.

POR BYRON RAÚL MAZARIEGOS CHÁVEZ

ACTO QUE DEDICO

A DIOS Y LA VIRGEN MARÍA:

Por estar conmigo en cada paso que doy, por fortalecer mi corazón e iluminar mi mente y por haber puesto en mi camino a aquellas personas que han sido mi soporte y compañía durante todo el periodo de estudio.

A MIS PADRES:

Guido Humberto y Silda Ninet por todo su inmenso amor, ejemplo, valores, confianza, y apoyo en cada momento de mi carrera. Este triunfo es de ustedes se lo merecen los amo con todo mi corazón. Son lo mejor que tengo en la vida.

A MIS HERMANOS:

Humberto y Johanna por su amor, apoyo y confianza en todo lo necesario para cumplir mis objetivos como persona y estudiante, los quiero mucho.

A MIS SOBRINITAS:

Paula María y Ana Sofía por ser esa luz, esa alegría y esa motivación para seguir adelante, las quiero muchísimo.

A MI CUÑADO:

Fredi por todo el apoyo, ánimo pero sobre todo cariño y amistad.

A MI FAMILIA:

Abuelitos, Tíos, primos, por su cariño, apoyo y comprensión y que de una u otra manera me han llenado de sabiduría para terminar la carrera, gracias por todo.

A MIS AMIGOS:

Karla, Carlos, Pablo, Sergio, Bea, Quiroa, Miguel, Esteban, Jerez, Lesly, Rafa, Luis, Mynor, Pablo, Alejandra, Marvin, Lidia, Cazali, Yeni, Mario, Peter, Rolan, Martin, Checha, Jaime, Javier, Saúl, y a mis amigos del grupo de EPS (chato, José, Pancho, Jonnathan, Rodrigo, Rosita, Claudia), por su amistad, alegrías y experiencias compartidas.

POR SERGIO IVÁN VÁSQUEZ LUNA

ACTO QUE DEDICO

A DIOS:

A Dios, por haberme permitido culminar esta meta, iluminándome en momentos difíciles y de alegrías.

A MIS PADRES:

A Elsa y Danilo, mi mayor admiración para ustedes, gracias por sus buenos consejos, por su apoyo por haberme enseñado que una meta nunca es imposible de alcanzar cueste lo que cueste, gracias por sus sacrificios, madre les dedico este acto con mucho amor.

A MIS ABUELOS:

Celso Luna y Juliana Hernández por ser como dos padres para mí, por apoyarme, por ser su hijo, por tenderme la mano, por siempre estar conmigo, muchas gracias los amo.

A MIS HERMANOS:

Henry, Lesly, Sandra y Cristal, todos y cada uno, me dieron palabras de aliento, y me han apoyado en todo este largo trayecto los amo.

A MI HIJO:

IanDereckDiaz, mi mayor motivación, mi razón para no rendirme te amo Ian.

A MIS SOBRINOS:

Alexis, Jeikan y Carlitos, por formar parte de mi vida y ser los actores de mis alegrías.

A MIS CUÑADOS, TIOS Y PRIMOS:

Luwin, Bety, Mirza, Mynor, Flory, David, Manuel, Wesly, Angelito, Lupita, Julio, July, Saray, Maudy, Marvin, Carlili, Julia, Mariana, Jackeline, David, Martin, en memoria de Rene, Axel y Tio Tono, que en paz descansen sus almas

A MIS AMIGOS:

Grace, Manolo, Yony, Edward, Yuliani, Cristian Evelyn, David, Alejandra, Pinki, Marisol, Kevin, Wilson, Yosselin, Roberto, Gerbert, Yaneth, Pablo Reyes, Byron Mazariegos, Karla, Lourdes, Mario, Marvin, Iván, Claudia, Rodolfo Fiallos, Lesly, José, Mynor, Mark, Edgar, Javier, Taco, Tikalia, Belsy, Aracely, Amanda, Jaime, Max, Luis, Robert, Lucrecia, por compartir conmigo momentos inolvidables, a todos y cada uno se les quiere mucho.

POR PABLO RUBÉN REYES BRAVO

AGRADECIMIENTOS

A DIOS Y LA VIRGEN MARÍA:

Por haberme permitido culminar esta etapa de mi vida regalándome día a día muchas bendiciones y darme fuerzas para seguir adelante en momentos que lo necesite e iluminarme el camino que he recorrido.

A MIS PADRES:

Porque este logro es de ustedes también, por todo el esfuerzo y lucha que hicieron para que nunca me hiciera falta nada, porque siempre recorrieron conmigo este camino apoyándome y llenándome de sabios consejos y sobre todo de mucho amor.

A LA UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA:

En especial a la Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia porque me han otorgado la formación académica a nivel profesional.

A LA LICENCIADA LORENA CERNA:

Por su apoyo, ayuda, amistad y por todas sus enseñanzas durante la asesoría del trabajo de seminario, muchas gracias licenciada por el tiempo que nos dedicó.

A LA LICENCIADA ALBA DE TORRES:

Por ser una excelente persona que nos brindó su tiempo, su amistad, sus conocimientos y su experiencia en la revisión del seminario, gracias por su valiosa ayuda licenciada.

AL CENTRO GUATEMALTECO DE INFORMACIÓN DE MEDICAMENTOS (CEGIMED). Y AL IGSS “DR. JUAN JOSÉ ARÉVALO BERMEJO” (ZONA 6).

Por permitirnos utilizar sus instalaciones durante el proceso de asesoría y revisión del seminario.

POR BYRON RAÚL MAZARIEGOS CHÁVEZ

AGRADECIMIENTOS

A DIOS Y LA VIRGEN MARÍA:

Por la vida que nos regala, por permitirme cumplir con este sueño y por todas las bendiciones recibidas durante cada día de mi vida.

A MIS PADRES:

No tengo palabras para decirles lo agradecido que estoy con ustedes por permitirme llegar a la meta, gracias por todo su esfuerzo, amor, dedicación, y por apoyarme siempre en todo momento, sin ustedes no fuera posible este triunfo. GRACIAS.

A LA UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA:

Especialmente a la Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia por otorgarme mi formación académica como profesional.

AL HOSPITAL REGIONAL JUAN JOSE ORTEGA DE COATEPEQUE:

Por darme la oportunidad de realizar mi EPS y en especial al Área de Farmacia Interna por su apoyo, ayuda y enseñanzas durante el tiempo compartido con ustedes, gracias por todo.

A LA LICENCIADA LORENA CERNA:

Por su apoyo, ayuda, amistad y por todas sus enseñanzas durante la asesoría del trabajo de seminario, muchas gracias licda. por el tiempo que nos dedicó.

A LA LICENCIADA ALBA DE TORRES:

Por ser una excelente persona que nos brindó su tiempo, su amistad, sus conocimientos y su experiencia en la revisión del seminario, gracias por su valiosa ayuda licda.

AL CENTRO GUATEMALTECO DE INFORMACIÓN DE MEDICAMENTOS (CEGIMED). Y AL IGSS “DR. JUAN JOSÉ ARÉVALO BERMEJO” (ZONA 6).

Por permitirnos utilizar sus instalaciones durante el proceso de asesoría y revisión del seminario, gracias por todo.

A MIS AMIGOS:

Pablo Reyes, Sergio Luna, Carlos Soto por todos esos momentos de estudio, alegrías, desvelos en el 23 y sobre todo por su sincera amistad y esos recuerdos que siempre nos quedarán grabados en la mente.

POR SERGIO IVÁN VÁSQUEZ LUNA

AGRADECIMIENTOS:

A DIOS:

Por darme la vida, por bendecir mi vida con estos éxitos que gracias a su ayuda obtengo el día de hoy, gracias Dios por todas las bendiciones recibidas.

A MI MADRE:

Por darme todo el amor que una madre puede dar, por estar siempre ahí, porque se que sin tus palabras de aliento me hubiera rendido, mami, gracias por todo tu sacrificio, por tu dedicación, por tus fuerzas, por todo te agradezco por todo madre linda te amo.

A LA UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA:

A la Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia, Escuela de Química Farmacéutica; por brindarme los conocimientos necesarios para culminar mi formación profesional.

A GRACIELA ELIZABETH DIAZ CAMPOS:

Por ser una de las personas más importantes en mi vida, me acompañaste a lo largo de la carrera, me motivaste, y me apoyaste, no permitiste que me rindiera nunca, gracias, te doy infinitas gracias por enseñarme el valor del amor y de la amistad te lo agradezco desde el fondo de mi corazón, gracias por existir.

A MIS AMIGOS:

Pablo Reyes, Byron Mazariegos, porque formaron parte de este éxito, durante las jornadas de estudio, siempre había un motivo para estar felices, sin ustedes hoy no estaría aquí, gracias porque me apoyaron, Rodolfo Fiallos (Chofo), Jaime y Max, quienes siempre nos instaban a seguir de quienes guardo muchos buenos recuerdos, gracias por esa amistad tan sincera y honesta.

A MIS HERMANOS:

Sandra, mi mayor fuente de inspiración, sin tu ejemplo no hubiera seguido escalando, Henry, mi brazo derecho, mi mejor amigo, mi hermano del alma, lo mejor que Dios me pudo dar, Cristal y Lesly, muchas gracias por todo el apoyo que he recibido de ustedes.

A MIS TIOS:

Mis dos mentores de la niñez, uno me enseñó lo bonito que era la naturaleza e hizo que me inspirara en la química, el otro me enseñó con el ejemplo a estudiar y

trabajar sin rendirse nunca, muchas Gracias Tío Tono y Tío Otto en paz
descansen sus almas, agradezco sus enseñanzas.

INDICE

1.	RESUMEN.....	1
2.	INTRODUCCION.....	2
3.	ANTECEDENTES.....	3
4.	JUSTIFICACION.....	15
5.	OBJETIVOS.....	16
6.	MATERIALES Y METODOS.....	17
7.	RESULTADOS.....	20
8.	DISCUSION DE RESULTADOS.....	23
9.	CONCLUSIONES.....	27
10.	RECOMENDACIONES.....	28
11.	REFERENCIAS.....	29
12.	ANEXOS.....	34

1. RESUMEN

El vademécum es una obra de referencia que contiene la información farmacológica de mayor interés en el ámbito clínico, referencia en la que pueden consultar sobre presentaciones, composiciones y las principales indicaciones de los medicamentos.

El objetivo de la elaboración de la Implementación del Vademécum de medicamentos nombrados por Denominación Común Internacional en Guatemala Fase III comprendiendo los medicamentos de la letra N a la Z, es brindar información científica y actualizada de productos farmacéuticos registrados en Guatemala, basándose en literatura científica y actualizada y ser una referencia accesible para el personal de salud. .

La selección se realizó en base a los medicamentos que se encuentran registrados en el Ministerio de Salud y Asistencia Social de Guatemala, los cuales se encuentran listados por su Denominación Común Internacional (DCI).

Cada monografía incluye la siguiente información: Nombre del principio activo, nombre químico y/o sinónimo, categoría farmacoterapéutica, estructura química, indicaciones, farmacodinamia, farmacocinética, dosis, contraindicaciones y precauciones, interacciones con medicamentos, efectos adversos, advertencias especiales, interferencias analíticas, intoxicación y su tratamiento y referencias.

2. INTRODUCCIÓN

El presente trabajo es la III fase de un Vademécum de Medicamentos nombrados por Denominación Común Internacional (DCI) en Guatemala comprendiendo los medicamentos de la letra N a la Z.

La información consignada fue compilada de referencias científicas actualizadas; en cada monografía se incluyó la siguiente información: presentaciones disponibles en Guatemala, la forma farmacéutica, nombre del principio activo, nombre químico o sinónimo, categoría farmacéutica, estructura química, indicaciones, farmacodinamia, farmacocinética, dosis, contraindicaciones, precauciones, interacciones con medicamentos, interferencias analíticas, efectos adversos, advertencias especiales y el tratamiento en caso de intoxicación.

Este vademécum contiene información que esta destinada para el personal que labora en el área de salud: médicos, enfermeras, químicos farmacéuticos, químicos biólogos, odontología.

3. ANTECEDENTES

3.1. Uso Racional de Medicamentos:

Los medicamentos juegan en la actualidad un papel fundamental en la asistencia sanitaria. Este papel puede observarse considerando a los medicamentos como “herramientas”, o medios de los que se vale el proveedor de salud para modificar el curso natural de una enfermedad, prevenirla o diagnosticarla. (Oliva, 2008).

La Organización Mundial de la Salud (OMS) definió “El uso racional de los medicamentos, exige que los pacientes reciban los medicamentos apropiados para sus necesidades clínicas, a dosis que se ajusten a sus requerimientos individuales, durante un periodo adecuado y al costo más bajo posible para ellos y para la comunidad”. (OMS, 2006). La lógica de la selección y el empleo de un número limitado de medicamentos esenciales es que conduce a una mejora en el suministro de los medicamentos. (López, 2008). Dicha definición abarca el uso de buena calidad (es decir, correcto y apropiado) de los medicamentos por parte de quienes los prescriben y de quienes los consumen, concepto que incluye la observancia del tratamiento.

El uso racional de los medicamentos en todas las afecciones médicas es fundamental para que se pueda ofrecer acceso universal a una atención sanitaria adecuada, para que se cumplan los derechos humanos relacionados con la salud y para que se logren los Objetivos de Desarrollo del Milenio relacionados con la salud. (OMS, 2006)

El alcance del uso racional o de buena calidad de los medicamentos abarca la eliminación de su sobreutilización e infrautilización, así como la inobservancia del tratamiento, especialmente en los trastornos crónicos como el SIDA o la diabetes.(OMS, 2006)

El uso racional de los medicamentos en un contexto biomédico incluye criterios tales como: un medicamento prescrito, dispensado y utilizado correctamente, prescripción basada en consideraciones médicas sólidas, medicamento apropiado desde el punto de vista de eficacia, seguridad e idoneidad para el paciente, posología, administración y duración del tratamiento apropiadas, paciente apropiado tomando en cuenta la seguridad para el paciente y que la probabilidad de reacciones adversas sea mínima, dispensación correcta que incluya información para el paciente sobre los medicamentos prescritos, y que el paciente cumpla con el tratamiento.

El prescriptor ha de decidir basándose en consideraciones de eficacia, seguridad, idoneidad y costo, que tratamiento se requiere para conseguir el objetivo terapéutico deseado en cada paciente, luego de la decisión de tratar al paciente con medicamentos, se selecciona el mejor fármaco para cada paciente individual, basándose en consideraciones de eficacia, seguridad, idoneidad y costo.

3.2. Uso Irracional de Medicamentos:

La OMS calcula que más de la mitad de los medicamentos se prescriben, dispensan o venden de forma inapropiada, y que la mitad de los pacientes no los toman correctamente. Este uso incorrecto puede adoptar la forma de un uso excesivo, insuficiente o indebido de medicamentos de venta con o sin receta.(OMS, 2010)

Entre los problemas frecuentes del uso irracional de medicamentos se encuentran:

1. La polifarmacia (consumo de varios medicamentos simultáneamente);
2. El uso excesivo de antibióticos;
3. La prescripción no ajustada a directrices clínicas;
4. La automedicación inapropiada.

3.2.1. Consecuencias del uso incorrecto de los medicamentos:

El uso incorrecto de los medicamentos ocurre en todos los países, es nocivo para los pacientes y constituye un desperdicio de recursos. Entre sus consecuencias se encuentran:

3.2.1.1. La resistencia a los antimicrobianos:

El uso excesivo de antibióticos aumenta la resistencia a los antimicrobianos y el número de medicamentos que dejan de ser eficaces para combatir las enfermedades infecciosas. Muchos procedimientos quirúrgicos y los tratamientos antineoplásicos no son posibles sin antibióticos para luchar contra las infecciones. La resistencia prolonga las enfermedades y las estancias hospitalarias, y puede llegar a causar la muerte. (OMS, 2010)

3.2.1.2. Las reacciones adversas a los medicamentos y los errores de medicación:

Las reacciones adversas a los medicamentos originadas por su uso erróneo o por reacciones alérgicas pueden ser causa de enfermedad, sufrimiento y muerte. (OMS, 2010)

3.2.1.3. El desperdicio de recursos:

La compra de medicamentos directamente por el usuario puede causar graves dificultades económicas a los pacientes y a sus familias. Si los medicamentos no se prescriben y usan adecuadamente, se desperdician fondos. (OMS, 2010)

3.2.1.4. La pérdida de confianza del paciente:

El uso excesivo de medicamentos escasos contribuye a menudo al agotamiento de existencias y al aumento de los precios hasta niveles inasequibles, lo cual merma la confianza del paciente. Los malos resultados sanitarios debidos al uso inadecuado de los medicamentos también pueden reducir la confianza. (OMS, 2010)

3.2.2. Factores que contribuyen al uso incorrecto de los medicamentos:

- 3.2.2.1.** Falta de conocimientos teóricos por parte del paciente a la hora de consumir medicamentos de venta libre.
- 3.2.2.2.** Promoción de los medicamentos inapropiada y contraria a la ética por parte de las empresas farmacéuticas.
- 3.2.2.3.** Beneficios de la venta de medicamentos.
- 3.2.2.4.** Disponibilidad de medicamentos sin restricciones. Venta libre de medicamentos de manera excesiva, conduce a la automedicación inapropiada y a la inobservancia de los regímenes posológicos.
- 3.2.2.5.** Sobrecarga de trabajo del personal sanitario.
- 3.2.2.6.** Medicamentos inasequibles.
- 3.2.2.7.** Inexistencia de políticas farmacéuticas nacionales coordinadas.

3.3. Estrategias Para Mejorar el Uso de los Medicamentos:

Las estrategias para hacer frente al uso irracional de medicamentos son de tipo educativo, gerencial o regulatorio. Cualquiera que sea el método

elegido para codificar la utilización de los medicamentos, debe centrarse en los factores básicos del problema recurriendo a fuentes bibliográficas actualizadas y confiables así como a canales de comunicación fiables para así poder transmitir cierto número de mensajes básicos. (OMS, 2002).

3.4. Documentos farmacológicos que aportan beneficio al uso racional de medicamentos:

3.4.1. Guía de Medicamentos: Una guía de medicamentos contiene información detallada sobre la farmacología, farmacocinética y farmacodinamia de cada uno de los medicamentos de una forma clara y concisa, donde cada medicamento está clasificado por grupo terapéutico. Este documento proporciona información sobre vía de administración, concentración, presentación, modo de preparación, tamaño del vial, volumen a diluir, soluciones masivas compatibles, administración e interacciones con otros medicamentos. (Girón, 1997)

3.4.2. Lista Básica de Medicamentos: La lista básica de medicamentos es un documento en el cual se detallan todas las presentaciones de los medicamentos utilizados para el tratamiento farmacológico de un hospital, proporcionando información sobre nombre genérico, forma farmacéutica, presentación (concentración) y almacenamiento. El objetivo principal es asegurar la existencia de productos para la morbilidad atendida, así como la optimización de los recursos con que dispone un hospital. (Girón, 1997).

3.4.3. Formulario Terapéutico: Un formulario terapéutico contiene una recopilación de productos farmacéuticos aprobados para la utilización del tratamiento farmacológico, su objetivo es guiar al profesional que prescribe medicamentos, proveyéndole una gama de medicamentos

disponibles para tratar los diferentes casos clínicos que se le presenten y utilizándose como un instrumento de selección.

Un formulario terapéutico contiene monografías que proporcionan información farmacológica, nombre genérico del medicamento, presentación disponible en el hospital, clasificación farmacológica y terapéutica, clasificación de riesgo en embarazo, lactancia, indicaciones, contraindicaciones, reacciones adversas, vía de administración y dosis.(Girón, 1997).

3.4.4. Guía Farmacológica. Una guía farmacológica contiene información resumida sobre un número selecto de medicamentos tomando como base, por lo general una lista de medicamentos esenciales, no es un compendio completo, ni habitualmente cubre todos los medicamentos en el mercado. Es más bien una referencia práctica que contiene información selecta de relevancia para el prescriptor, el dispensador, la enfermera o cualquier otro tipo de trabajador sanitario, y sirve de apoyo para una gestión correcta de los medicamentos y el uso racional de los mismos. Comúnmente una guía farmacológica incluye la denominación genérica de un medicamento, sus indicaciones de uso, posología, contraindicaciones, efectos secundarios e información importante que debe darse al paciente. (OMS, 2002).

3.4.5. Monografía de medicamentos: Una monografía provee información sobre: grupo terapéutico, indicaciones, mecanismo de acción, uso en embarazo y lactancia (según la FDA, *Food and Drug Administration*), precauciones, contraindicaciones, reacciones adversas de los medicamentos, interacciones, estabilidad de los productos farmacéuticos, concentración, pH de la solución, almacenamiento e incompatibilidades fisicoquímicas. (Agvik, 2007).

3.4.6. El vademécum: Es una obra de referencia que contiene la información farmacológica, de mayor interés en el ámbito clínico, donde destacan particularmente los fármacos que utilizan frecuentemente los profesionales sanitarios, para consultar sobre presentaciones, composiciones y las principales indicaciones de los medicamentos. Este documento se mantiene constantemente a la mano para su consulta.

3.5. Búsqueda de información científica: “Existen muchas formas de información de medicamentos (materiales escritos y audiovisuales, discos de ordenador, por ejemplo) y la necesidad de esta información varía en los diferentes tipos de prestadores de asistencia sanitaria y pacientes” (Castellanos 2009). Las fuentes de información se refieren a cualquier clase de conocimiento o mensaje que puede utilizarse para mejorar o posibilitar la intervención. Tiene como objetivos conocer los tipos de información disponible, saber en dónde buscar la información y evaluar su disponibilidad.

3.5.1. Características de la información sobre medicamentos: Debe ser accesible, fiable, completa y aplicable.

3.5.2. Tipos de fuentes:

- **Primarias:** Contienen la información más reciente e idealmente debería ser utilizada en la resolución de consultas complejas, en particular las que involucran a pacientes.
- **Secundarias:** Permiten una evaluación rápida y selectiva de la literatura primaria en la búsqueda de la información específica. Estas fuentes se presentan en forma de resumen de las referencias primarias, por lo que no se presenta una información completa.
- **Terciarias:** Son las más utilizadas, permiten resolver la mayoría de las consultas en forma fácil y concreta. Tienen como desventaja que

no recolectan los desarrollos recientes o investigaciones realizadas durante y después de la publicación. (Cerna, 2011)

3.6. Información de Medicamentos: Como información de medicamentos entendemos el conjunto de conocimientos y técnicas que permiten la transmisión de conocimientos en materia de medicamentos, con la finalidad de optimizar la terapéutica en interés del paciente y la sociedad. En Guatemala existe un Centro de Información de Medicamentos –CEGIMED- fundado el 22 de septiembre de 1988.

3.7. Calidad de información de medicamentos: Cada monografía es una recopilación de bibliografías variadas y analizadas, con la finalidad de que cada medicamento que este contenido en el presente vademécum contenga los requerimientos básicos que el investigador necesite, facilitando de esta manera que el usuario encuentre información clara y certera.

3.8. Medicina basada en evidencias: Propone la práctica de la medicina en base al sustento de evidencias de la mejor calidad posible, de modo que el riesgo de equivocaciones se reduzca al mínimo. Puede ser conceptualizada como un proceso que frente a una situación definida, clínica o no clínica, procura responder a las interrogantes, por medio de una búsqueda, orientada por criterios preestablecidos y de datos en los cuales va a basar sus acciones, o sea, su producto final.

Este modelo consta de 4 etapas sucesivas: Formulación clara de un problema clínico determinado, búsqueda en la literatura correspondiente de trabajos relevantes, evaluación crítica de las evidencias en relación con su validez y utilización, y la implementación en la práctica clínica de aquellas evidencias encontradas.

Objetivos de la medicina basada en evidencias:

- Evaluación de la literatura médica: Debido al gran número y crecimiento exponencial de las publicaciones, además de su calidad, muchas veces perjudicada por fallas estadísticas y referencias inadecuadas, los resultados de determinado trabajo deben ser analizados, en relación con su validez, importancia y aplicación.
- Reducción del margen de error: Deriva de acciones fundamentales en evidencias externas, las cuales sufrieron análisis estadísticos depuradores. Los criterios clínico-epidemiológicos y los datos estadísticos contribuyen a fortalecer las evidencias externas.
- Sistematización de la educación continuada: Debido a la facilidad de acceso a las informaciones y los criterios utilizados para seleccionarlas, la actualización de los conocimientos es un proceso dinámico que tiene 3 requisitos básicos: El reconocimiento de la necesidad de informaciones, la obtención de las mismas y la determinación de su valor científico.
- Limitación del autoritarismo: En la enseñanza y en la práctica médica, además del estímulo a la iniciativa y la creatividad personal proporcionada por el ejercicio de la medicina basada en evidencias, la experiencia es válida cuando está sostenida en evidencias.
- Racionalización de los costos: La disminución de los errores y el aumento de la calidad asistencial son importantes factores en la reducción de los costos.
- Humanización de la relación médico-paciente: El exigir la formulación precisa del problema, lo cual requiere de un interrogatorio minucioso y un examen físico completo, determinando con exactitud todos los problemas del paciente incluidos los psicólogos, familiares y sociales,

ayuda a la evaluación y tratamiento de todas las necesidades de salud del paciente, no sólo las biológicas.

De lo dicho anteriormente se desprende que la Medicina Basada en Evidencias tiene tres componentes básicos: La pericia clínica, la evidencia externa, y las preferencias de los pacientes. Una combinación adecuada de las tres, se dice, es indispensable para lograr esta práctica médica diferente. (Scielo 2000).

3.9. Estudios Previos

3.9.1. Estudios a nivel nacional:

En Guatemala se han realizado trabajos de investigación enfocados a proporcionar información para brindar mejor atención clínica en relación al uso de medicamentos racional, dichos trabajos fueron realizados basados en el listado básico de medicamentos de un hospital determinado, pero este vademécum contiene los Medicamentos por Nombre bajo la denominación común internacional registrados en Guatemala, que contiene la información de mayor importancia y que más comúnmente se necesita, al recopilar información de múltiples fuentes bibliográficas confiables, el vademécum se convierte en un documento de vital importancia en el área clínica en general.

Entre los trabajos realizados con estos propósitos se pueden citar:

3.9.1.1. Agvik España, Claudia Esperanza. (2007) Elaboración de lista básica de medicamentos y elaboración y validación de una guía farmacológica dirigida a personal de enfermería del Hospital Nacional Rodolfo Robles de Quetzaltenango.

- 3.9.1.2.** Corado Jiménez, Boris Iván. (2007) Guía farmacológica dirigida al personal auxiliar de enfermería de los centros y puestos de salud que integran la Dirección de Área de Salud de Quetzaltenango.
- 3.9.1.3.** García Guzmán, Reina Consuelo. (2005) Guía farmacológica dirigida a personal médico, enfermeras y auxiliares de enfermería del Hospital Nacional de Salamá, Baja Verapaz.
- 3.9.1.4.** García Romero, Astrid Vanessa. (2008) Elaboración y evaluación de una guía farmacológica de la lista básica de medicamentos del Hospital Distrital de Poptún, Petén. Dirigida a personal médico y enfermeras graduadas.
- 3.9.1.5.** Ríos Carredano, Elisa Beatriz.(2006) Revisión y actualización de la lista básica y formulario terapéutico del Hospital Roosevelt.
- 3.9.1.6.** Roldan Gregorio, Ethel Virginia, (2007) Monografías De Medicamentos Mas Usados En El Tratamiento De Hipertensión Arterial, Como Soporte Para La Dispensación Activa A Través Del Subprograma De Atención Farmacéutica En La Farmacia Universitaria.
- 3.9.1.7.** Méndez Dardón, R. (2001). Guía Farmacoterapéutica del Hospital Nicolasa Cruz.
- 3.9.1.8.** López Leal, Pamela. (1999). Guía Farmacológica dirigida a auxiliares de enfermería de servicios clínicos de adultos del Hospital Roosevelt.
- 3.9.1.9.** Mijangos Sandoval, Flor de María. (1999) Guía farmacológica dirigida a auxiliares de enfermería de los servicios clínicos del departamento de Pediatría del Hospital Roosevelt.

- 3.9.1.10.** Macario Alvarado, Mathilde Alfonsina. (1998) Evaluación del uso de medicamentos que son administrados por los padres de familia a sus niños, que acuden al área de consulta externa de la emergencia del hospital regional de Zacapa.
- 3.9.1.11.** León Roque, María Carolina. (2006) Actualización y Validación Guía Terapéutica De Medicamentos Inyectables Dirigida a Personal de Enfermería del Hospital Nacional de San Marcos

4. JUSTIFICACION

La realización del presente vademécum surgió con la necesidad que se tiene en Guatemala de poder obtener información científica, actualizada y confiable de productos farmacéuticos, nombrados por su denominación común internacional, sin tomar en cuenta laboratorios productores o marcas comerciales que son utilizados en las aéreas de salud, tomando en cuenta que en Guatemala no se cuenta en nuestro país con un documento de información como el que se llevó a cabo.

5. OBJETIVOS

5.1. Objetivo general:

Brindar información científica y actualizada de productos farmacéuticos de mayor uso en Guatemala.

5.2. Objetivos específicos:

5.2.1. Presentar la información de las monografías de forma clara y organizada basándose en una literatura científica confiable.

5.2.2. Actualizar la información de los medicamentos que están listados bajo la denominación común internacional registrados en Guatemala.

5.2.3. Establecer este vademécum como una herramienta de primera mano en la búsqueda de información de medicamentos en Guatemala.

6. MATERIALES Y METODOS

6.1. Universo:

Medicamentos registrados en Guatemala por denominación común internacional.

6.2. Recursos humanos:

Asesora: Licda. Lorena Cerna

Investigadores:

Br. Pablo Rubén Reyes Bravo

Br. Byron Raúl Mazariegos Chávez

Br. Sergio Iván Vásquez Luna

6.3. Materiales y suministros:

Referencias:

- Libros en electrónico entre ellos:
 - Martindale. (2003). The Complete Drug Reference 36 Edition. Pharmaceutical Press. Inglaterra.

- Libros en físico:
 - AHFS Drug Information (2011). American Society of Health-System Pharmacists edited by G.K. McEvoy et al.
 - Martindale. (2003). The Complete Drug Reference 36 Edition. Pharmaceutical Press. Inglaterra.

- Taketomo, C. y Hodding, J. (2012). Manual de Prescripción Pediátrica .18ª Edición. Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. México.
- Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. 19a Edición. Editorial Inter. Sistemas Lexi comp . México.

- Hojas de papel bond
- Tinta para impresora
- Folders
- Transporte (vehículo automotor y moto)
- Combustible para medios de transporte

Recursos tecnológicos:

- Corriente eléctrica
- Fotocopiadora
- Computadora (portátil y de escritorio)
- Scanner
- Impresora
- Internet

6.4. Método:

- 6.4.1. Elaboración de protocolo de investigación.
- 6.4.2. Presentación de protocolo y aprobación por escuela.
- 6.4.3. Búsqueda de información farmacológica en fuentes bibliográficas confiables y actualizadas.
- 6.4.4. Selección y resumen de información sobre los medicamentos asignado de la letra N a la Z.
- 6.4.5. Elaboración de monografías farmacológicas en base al formato establecido por el Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos –CEGIMED-.
- 6.4.6. Revisión de monografías.
- 6.4.7. Realización y aprobación del informe final de investigación.

6.5. Tipo de investigación:

Descriptiva documental.

7. RESULTADOS

Es la elaboración del Vademécum de las monografías de los medicamentos comprendiendo de la letra N a la Z, nombrados por Denominación Común Internacional registrados en Guatemala. (Ver Anexo 1).

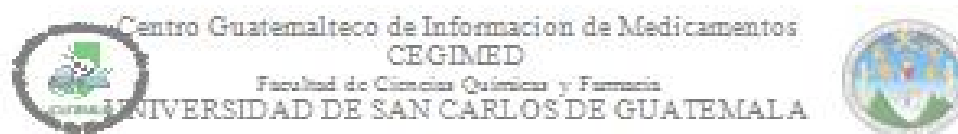
Se elaboraron un total de 79 monografías, las cuales se listan a continuación:

Tabla No.1: listado de monografías

No.	Medicamento	No.	Medicamento
1	Nafazolina	21	Pirazinamida
2	Naproxeno	22	Piroxicam
3	Nevirapina	23	Pravastatin
4	Nifedipina	24	Primaquina
5	Nimodipina	25	Probenecid
6	Nistatina	26	Progesterona
7	Nitazoxanidina	27	Propofol
8	Nitrato de Miconazol	28	Propranolol
9	Nitrofurantoina	29	Rabeprazol
10	Norfloxacina	30	Ramipril
11	Ofloxacina	31	Ranitidina
12	Olanzapina	32	Ribavirina
13	Omeprazol	33	Riboflavina
14	Oximetazolina	34	Rifampicina
15	Oxitocina	35	Ritonavir
16	Paclitaxel	36	Salbutamol
17	Pantoprazol	37	Saquinavir
18	Paroxetina	38	Secnidazol
19	Pemetrexed	39	Selegilina
20	Penciclovir	40	Sertralina

No.	Medicamento	No.	Medicamento
41	Subsalicilato de Bismuto	61	Tiomersal
42	Succinato de Doxilamina	62	Tiopental Sódico
43	Succinato Sódico de Cloranfenicol	63	Tioridazina
44	Succinilcolina cloruro	64	Tobramicina
45	Sucralfato	65	Topiramato
46	Sulfacetamida Sódica	66	Toxoide Diftérico-Tetánico
47	Sulfadiazina de Plata	67	Tramadol
48	Sulfato Ferroso	68	Trihidrato de Ampicilina
49	Sumatriptán	69	Trimetropin
50	Tacrolimus (Cápsulas)	70	Tropicamida
51	Tacrolimus (Tópico)	71	Valaciclovir
52	Tatrato de Tolterodina	72	Valerato de Betametasona
53	Tazaroteno	73	Valsartan
54	Telmisartán	74	Venlafaxina
55	Teofilina	75	Verapamil
56	Terazosina	76	Warfarina Sódica
57	Tibolona	77	Zidovudina
58	Ticlopidina	78	Zinc
59	Tinidazol	79	Zolpidem Tartrato
60	Tioconazol		

Imagen No. 1. Diseño del formato de monografías farmacológicas.



NOMBRE DEL MEDICAMENTO (DCI)

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO	INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:
FORMA FARMACEUTICA:	EFECTOS ADVERSOS:
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINÓNIMO:	ADVERTENCIAS ESPECIALES:
CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:	INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:
ESTRUCTURA QUÍMICA:	REFERENCIAS:
INDICACIONES:	
FARMACODINAMIA:	
FARMACOCINÉTICA:	
DOSES:	
CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:	

8. DISCUSION DE RESULTADOS

La información de medicamentos es el conjunto de conocimientos y técnicas que permiten la transmisión de conocimientos en materia de medicamentos, con la finalidad de optimizar la terapéutica en interés del paciente y la sociedad.

En las distintas áreas de salud, es de suma importancia contar con información sobre medicamentos proveniente de fuentes bibliográficas confiables y actualizadas, para mejorar la calidad del tratamiento farmacoterapéutico. Las fuentes de información más confiables y actualizadas son las primarias, las cuales poseen contenidos de los estudios de carácter científico más recientes, sin embargo estas se caracterizan por ser inaccesibles por su alto costo o bien se encuentran en idiomas extranjeros.

Por esta razón surgió la necesidad de recopilar información sobre medicamentos por denominación común internacional en base a las fuentes de información avaladas por la Organización Mundial de la Salud –OMS-, tales como el AHFS Drug Information (2011). American Society of Health-system Pharmacists, “Martindale, The Complete Drug Reference”; que a su vez están disponibles en el Centro de Información de Medicamentos de Guatemala –CEGIMED-. Así mismo dicho centro cuenta con el manual de prescripción médica elaborado por Charles, L; y el manual de prescripción pediátrica elaborado por Taketomo, C.

De esta manera se inicia con la elaboración de un Vademécum de medicamentos de denominación común internacional sin tomar en cuenta las marcas, registrados en el Ministerio de Salud y Asistencia Social de Guatemala, siendo éste una obra de referencia que contiene la información farmacológica, de mayor interés en el ámbito clínico, donde destacan particularmente los fármacos que utilizan los profesionales sanitarios, para consultar sobre presentaciones, composiciones y las principales indicaciones de los medicamentos.

Los medicamentos incluidos en dicho vademécum se encuentran nombrados por denominación común internacional (DCI) y están listados en orden alfabético, por lo que se divide en tres partes siendo ésta la fase III, que comprende las letras N a la Z.

Para su elaboración CEGIMED diseñó el formato de las monografías farmacológicas, el cual se presenta en la imagen No.1 en la sección de resultados. Dicho formato incluye el nombre del principio activo del medicamento el cual se encuentra en base a su DCI. Así mismo se distingue la forma farmacéutica, para que el profesional de la salud distinga principalmente la vía de administración.

Se menciona, el nombre químico o sinónimo, que servirá para que el lector distinga los otros tipos de nombres con los que se le conoce al mismo medicamento, además podrán identificar el medicamento basado en su estructura química, ya que las monografías incluyen el esquema químico propio de cada fármaco. Ésta información es complementada con la categoría farmacoterapéutica, con la cual se puede clasificar cada medicamento según sus indicaciones que de la misma manera son detalladas en cada monografía.

También se incluye la farmacodinamia, la cual brindara directamente el mecanismo de acción del fármaco, es decir, el efecto que el mismo provoca en el organismo al actuar en su sitio receptivo. Así mismo su farmacocinética, por medio de la cual se podrá corroborar los cambios que el cuerpo realiza sobre el medicamento. Tanto la farmacodinamia y la farmacocinética son de vital importancia en procesos fisiológicos, lo cual permitirá al lector determinar que órganos o que sitios del organismo serán los que estarán en contacto con el medicamento, pudiendo decidir si el hecho de que se encuentre en un determinado sitio sea benéfico o perjudicial para el paciente.

Cada monografía también cuenta con las dosis recomendadas que se utilizan en el área clínica, para los distintos pesos o edades de los pacientes, siendo esta información indispensable, porque al consultar el vademécum se puede determinar la posibilidad de dosis muy bajas que pueden producir un fallo terapéutico o bien una sobredosis que puede desembocar en una toxicidad para el organismo.

Una sección importante de cada monografía son las contraindicaciones y precauciones, donde se puede resumir los casos en los que no puede o debe ser administrado un medicamento.

En las interacciones, se consignan las razones por las cuales los medicamentos se pueden presentar en determinados casos inefectividad terapéutica, o bien modificar la efectividad de otros medicamentos administrados conjuntamente.

Las interferencias analíticas se refieren a las alteraciones que un fármaco puede provocar en las distintas pruebas de laboratorio, lo cual es de gran importancia para el personal médico ya que lo orientará en la interpretación de resultados analíticos.

Los efectos adversos proporcionan la información valiosa, ya que se puede deducir o predecir si el paciente posiblemente experimentara algún tipo de cambio fisiológico, que a su vez desembocará en alguna sintomatología característica, esta información puede ser útil para determinar las razones por las que el paciente presente algún efecto distinto a su patología. Un efecto adverso, así mismo puede provocar que el paciente disminuya su adherencia al medicamento.

Las advertencias se refieren a las precauciones a tomar en determinados estados de los pacientes como embarazo, lactancia, problemas renales o hepáticos de los pacientes.

Es importante para el personal de salud, conocer la manera de actuar en caso de intoxicación por sobredosis de fármacos, ya que estos en ocasiones ponen en riesgo la vida del paciente, por lo que en cada monografía se consigna el tratamiento recomendado.

Cada monografía consigna las fuentes de referencia respectivas.

De esta manera, se concluye que la información consignada en la fase III del Vademecum es un instrumento que puede utilizar el personal de salud para resolver sus dudas en cuanto a medicamentos se refiere; con la seguridad que lo que se consigna en el mismo es información, científica y actualizada.

9. CONCLUSIONES

- 9.1.** Se elaboraron las monografías consignadas en el vademécum nombrados por denominación común internacional en Guatemala (DCI), fase III comprendiendo los medicamentos de la letra N a la Z, utilizando información de fuentes confiables, actualizadas y sobre todo de carácter científico.
- 9.2.** Cada monografía se elabora según formato diseñado por CEGIMED (Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos).
- 9.3.** Cada monografía consigna: Nombre del principio activo, forma farmacéutica, nombres químicos o sinónimos, categoría farmacoterapéutica, farmacodinamia, farmacocinética, dosis, contraindicaciones y precauciones, efectos adversos, advertencias especiales, interferencias analíticas, intoxicaciones y referencias; el cual servirá como guía para una búsqueda adecuada de información en lo que respecta a medicamentos.
- 9.4.** La información consignada en el Vademecum fase III, constituye un instrumento valioso, para la busque de información por parte del personal de Salud en Guatemala, en cuanto a medicamentos se refiere.

10. RECOMENDACIONES

- 10.1.** Actualizar en forma periódica la información consignada en el Vademécum fase III.
- 10.2.** Diseñar el vademécum en forma electrónica para mayor facilidad de su utilización.

11. REFERENCIAS

- Agvik España, Claudia Esperanza. (2007). Elaboración de lista básica de medicamentos y elaboración y validación de una guía farmacológica dirigida a personal de enfermería del Hospital Nacional Rodolfo Robles de Quetzaltenango. Tesis de Licenciatura en Química Farmacéutica. Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia. Universidad de San Carlos de Guatemala. Guatemala. Disponible en: http://biblioteca.usac.edu.gt/tesis/06/06_2592.pdf
- Castellanos García, Erick Armando. (2009). "Guía Farmacoterapéutica Dirigida Al Personal De Auxiliar De Enfermería De Puestos De Salud Que Integran La Dirección De Área De Salud De Escuintla ".Tesis De Licenciatura En Química Farmacéutica. Facultad De Ciencias Químicas Y Farmacia. Universidad De San Carlos De Guatemala. Guatemala.
- Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos. (CEGIMED). (1993). Guía Farmacológica Para El Primer Nivel De Atención En Salud. Segunda Edición.
- Cerna, Lorena. (2000). Curso de atención farmacéutica. Búsqueda de información. Medicina basada en evidencias. Guatemala.
- Corado Jiménez, Boris Iván. (2007). Guía farmacológica dirigida al personal auxiliar de enfermería de los centros y puestos de salud que integran la Dirección de Área de Salud de Quetzaltenango. Tesis de Licenciatura en Química Farmacéutica. Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia. Universidad de San Carlos de Guatemala. Guatemala. Disponible en: http://biblioteca.usac.edu.gt/tesis/06/06_2563.pdf

Díaz, Novás, José. (2000). Medicina basada en evidencias. Disponible en:
<http://scielo.sld.cu/scielo.php>.

García Guzmán, Reina Consuelo. (2005). Guía farmacológica dirigida a personal médico, enfermeras y auxiliares de enfermería del Hospital Nacional de Salamá, Baja Verapaz. Tesis de Licenciatura en Química Farmacéutica. Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia. Universidad de San Carlos de Guatemala. Guatemala. Disponible en:
http://biblioteca.usac.edu.gt/tesis/06/06_2325.pdf

García Romero, Astrid Vanessa. (2008). Elaboración y evaluación de una guía farmacológica de la lista básica de medicamentos del Hospital Distrital de Poptún, Petén. Dirigida a personal médico y enfermeras graduadas. Tesis de Licenciatura en Química Farmacéutica. Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia. Universidad de San Carlos de Guatemala. Guatemala. Disponible en: http://biblioteca.usac.edu.gt/tesis/06/06_2681.pdf

Girón, N. Rodríguez de Biittner, M. (1997). Guía Para el Desarrollo de Servicios Farmacéuticos Hospitalarios: Selección y Formulario de Medicamentos. Serie Medicamentos Esenciales y Tecnología OPS. Pp. 5,6.

León Roque, María Carolina. (2006). “Actualización y Validación Guía Terapéutica De Medicamentos Inyectables Dirigida a Personal de Enfermería del Hospital Nacional de San Marcos”. Tesis De Licenciatura En Química Farmacéutica. Facultad De Ciencias Químicas Y Farmacia. Universidad De San Carlos De Guatemala. Guatemala

López Cruz, Henry Dirceo. (2008). “Guía Farmacológica Dirigida Al Personal Auxiliar De enfermería De Los Centros Y Puestos De Salud Que Integran La Dirección De Área De Salud De Baja Verapaz”. Tesis De Licenciatura

En Química Farmacéutica. Facultad De Ciencias Químicas Y Farmacia.
Universidad De San Carlos De Guatemala. Guatemala.

López Leal, Pamela. (1999). Guía farmacológica dirigida a auxiliares de enfermería de los servicios clínicos de adultos del hospital Roosevelt. Tesis de Licenciatura en Química Farmacéutica. Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia. Universidad de San Carlos de Guatemala. Guatemala. Disponible en: http://biblioteca.usac.edu.gt/tesis/06/06_1983.pdf

Macario Alvarado, Mathilde Alfonsina. (1998) Evaluación del uso de medicamentos que son administrados por los padres de familia a sus niños, que acuden al área de consulta externa de la emergencia del hospital regional de Zacapa. Tesis de Licenciatura en Química Farmacéutica. Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia. Universidad de San Carlos de Guatemala. Guatemala. Disponible en: http://biblioteca.usac.edu.gt/tesis/06/06_1912.pdf

Management science for Healt, Inc. En colaboración con OMS y OPS. Traducción Universidad Carlos III de Madrid. (2002). La Gestión del Suministro de Medicamentos. España. Pp.494-502.

Méndez Dardón, R. (2001). Guía Farmacoterapéutica del Hospital Nicolasa Cruz

Mijangos Sandoval, Flor de María. (1999). Guía farmacológica dirigida a auxiliares de enfermería de los servicios clínicos del departamento de Pediatría del Hospital Roosevelt. Tesis de Licenciatura en Química Farmacéutica. Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia. Universidad de San Carlos de Guatemala. Guatemala. Disponible en: http://biblioteca.usac.edu.gt/tesis/06/06_1987.pdf

Normas de Procedimiento en información de medicamentos. Disponible en:
<http://www.sefh.es/normas/norma9.pdf>

Olivia Galicia, Brenda Verónica. (2008) “Guía Farmacoterapeutica Dirigida A Personal De Enfermería Del Hospital General De Accidentes Del Instituto Guatemalteco De Seguridad Social” Tesis De Licenciatura En Química Farmacéutica. Facultad De Ciencias Químicas Y Farmacia. Universidad De San Carlos De Guatemala. Guatemala.

OMS. (2006). Uso racional de los medicamentos: progresos realizados en la aplicación de la estrategia farmacéutica de la OMS. Disponible en:
http://apps.who.int/gb/ebwha/pdf_files/EB118/B118_6-sp.pdf

OMS. (2010). Medicamentos: uso racional de medicamentos. Disponible en:
<http://www.who.int/mediacentre/factsheets/fs338/es/index.html>

Sicajá Cruz, César Augusto. (2005). Implementación de una base de datos de los productos farmacéuticos registrados en Guatemala. Tesis de Licenciatura en Química Farmacéutica. Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia. Universidad de San Carlos de Guatemala. Guatemala. Disponible en:
http://biblioteca.usac.edu.gt/tesis/06/06_2306.pdf

Sosa Ramírez, Marco Tulio. (2005). Guía de atención Básica y uso de medicamentos, guía de aprendizaje para personal de puestos y centros de salud. Ministerio de Salud Pública y Asistencia Social. Guatemala.

Ríos Galindo, Ana María. (1999). “Actualización Y Validación De La Guía Farmacológica Para El Primer Nivel De Atención En Salud, En El Departamento De Alta Verapaz”. Tesis De Licenciatura En Química Farmacéutica. Facultad De Ciencias Químicas Y Farmacia. Universidad De San Carlos De Guatemala. Guatemala

Ríos Carredano, Elisa Beatriz. (2006). Revisión y actualización de la lista básica y formulario terapéutico del Hospital Roosevelt. Tesis de Licenciatura en Química Farmacéutica. Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia. Universidad de San Carlos de Guatemala. Guatemala. Disponible en: http://biblioteca.usac.edu.gt/tesis/06/06_2392.pdf

Roldan Gregorio, Ethel Virginia. (2007). "Monografías De Medicamentos Mas Usados En El Tratamiento De Hipertensión Arterial, Como Soporte Para La Dispensación Activa A Través Del Subprograma De Atención Farmacéutica En La Farmacia Universitaria". Tesis de Licenciatura en Química Farmacéutica. Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia. Universidad de San Carlos de Guatemala. Guatemala.

12. ANEXOS



NAFAZOLINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Nafazolina

FORMA FARMACEUTICA:

Solución oftálmica

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

2-(1-Naftilmetil)-2-imidazolina.
(Martindale, 2009).

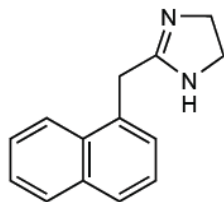
Sinónimos:

Clorhidrato de Nafazolina.
(Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente agonista adrenérgico oftálmico; Agente oftálmico vasoconstrictor. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Vasoconstrictor ocular tópico (para refrescar, humedecer y aliviar el Enrojecimiento secundario a irritación menor de los ojos). (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Estimula receptores adrenérgicos alfa en arteriolas de la conjuntiva y la mucosa nasal para producir vasoconstricción. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Oftálmica: por lo general el tratamiento no debe exceder tres o cuatro días; no se recomienda su empleo en niños < 6 años pues causa depresión del SNC (en especial en lactantes). (Taketomo, 2009).

Niños > 6 años y adultos (al 0.01 ó 0.1%): instilar una o dos gotas cada 3 a 4 h. (Taketomo, 2009).



CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Hipersensibilidad a la Nafazolina o cualquier componente de la fórmula, glaucoma de ángulo agudo, antes de iridectomía periférica (en pacientes sensibles a bloqueo de ángulo). (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar uso concomitante con lobengano 123, IMAO. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: estimulación cardiovascular sistémica (rara), palidez. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: mareo, cefalea, nerviosismo, ansiedad, tensión, estado soporoso, alucinaciones, convulsiones, depresión de SNC, psicosis prolongada. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, vómito. (Taketomo, 2009).

Locales: sensación punzante pasajera, irritación de la mucosa nasal, sequedad. (Taketomo, 2009).

Oculares: midriasis, elevación de la presión intraocular, visión borrosa, blefaroespasma (formulaciones oftálmicas). (Taketomo, 2009).

Respiratorias: dificultad para respirar, estornudos, congestión nasal de rebote (Formulaciones nasales). (Taketomo, 2009).

Diversas: diaforesis. (Taketomo, 2009).

REFERENCIAS:

1. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1766-1768.
2. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1100-1102.



NAPROXÉNO

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Naproxéno.
Naproxéno Sódico.

FORMA FARMACEUTICA:

Comprimidos.
Tabletas.
Tabletas recubiertas simples.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Acido (+)-6-Metoxi-a-metil-2-naftalenoacetico. (Martindale, 2009).

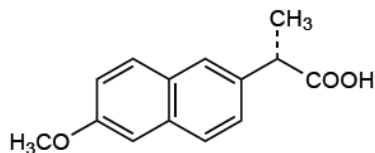
Sinónimos:

Naproxéno sódico. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antiinflamatorio; Analgésico no narcótico; Antipirético; Fármaco analgésico antiinflamatorio no esteroideo (AINE), oral. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martin Dale 2009

INDICACIONES:

Tratamiento de enfermedades inflamatorias y trastornos reumatoides (incluyendo artritis reumatoide y su variante juvenil, osteoartritis y espondilitis anquilosante); gota aguda; dolor leve o moderado; dismenorrea primaria; fiebre; tendinitis, bursitis. (Taketomo, 2009).

Nota: a causa de su absorción retardada, no se recomiendan las tabletas con este tipo de liberación para el tratamiento inicial del dolor. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Inhibe de manera reversible las enzimas ciclooxigenasa 1 y 2 (COX 1 y 2), lo cual ocasiona una disminución de la formación de los precursores de prostaglandinas, tiene propiedades antipiréticas, analgésicas y antiinflamatorias. (Lacy, 2011).

Otros mecanismos propuestos que no se han dilucidado por completo y es posible que contribuyan al efecto antiinflamatorio en grados variables, incluyen la inhibición de la quimiotaxis, la alteración de la actividad linfocitaria, la inhibición de la agregación/activación de los neutrofilos y la disminución de las concentraciones de citocinas pro inflamatorias. (Lacy, 2011).



FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** Oral: casi 100%. (Taketomo, 2009).
- **Distribución:** atraviesa la placenta; ~ 1% se distribuye en la leche materna. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:** > 99%. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** se metaboliza de manera extensa en el hígado hasta 6-O-desmetil Naproxéno; el fármaco original y el metabolito desmetil experimentan más metabolismo, hasta formar conjugados acilglucurónidos. (Taketomo, 2009).
- **Biodisponibilidad:** 95%. (Taketomo, 2009).
- **Vida media, eliminación:**
Niños: intervalo: 8 a 17 h
Niños de 8 a 14 años: 8 a 10 h
Adultos: 12 a 17 h. (Taketomo, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:**
Tabletas, Naproxéno: 2 a 4 h
Tabletas, Naproxéno sódico: 1 a 2 h
Tabletas de liberación retardada (con el estómago vacío): 2 a 6 h; Intervalo: 2 a 12 h
Tabletas de liberación retardada (con alimento): 12 h; intervalo: 4 a 24 h. (Taketomo, 2009).

- **Suspensión:** 1 a 4 h. (Taketomo, 2009).

- **Eliminación:** 95% se excreta en la orina (< 1% sin modificar; < 1% como 6-O-desmetil Naproxéno; 66 a 92% como sus conjugados); < 3% se excreta en las heces. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

DOSIFICACIÓN USUAL:

Nota: las dosis se expresan como Naproxéno base: 200 mg de Naproxéno base equivalen a 220 mg de Naproxéno sódico

Oral:

Niños > 2 años:

Analgesia: 5 a 7 mg/kg/dosis cada 8 a 12 h

Enfermedad inflamatoria, inclusive ARJ: usual: 10 a 15 mg/kg/día divididas en dos dosis; intervalo: 7 a 20 mg/kg/día; dosis máxima: 1 000 mg/día. (Taketomo, 2009).

Recomendación del fabricante para ARJ: 10 mg/kg/día divididos en dos dosis

Niños > 12 años y adultos < 65 años: etiquetado para venta sin receta, para dolor y fiebre: 200 mg cada 8 a 12 h; si es necesario pueden tomarse 400 mg como dosis inicial; dosis máxima: 600 mg/día. (Taketomo, 2009).

Adultos:

Artritis reumatoide, osteoartritis y espondilitis anquilosante: 500 a



1000 mg/día divididos en dos dosis.
(Taketomo, 2009).

Gota aguda: inicial: 750 mg, seguidos de 250 mg cada 8 h hasta que ceda el ataque. Nota: no se recomienda la tableta de liberación retardada debido a que se retrasa la absorción. (Taketomo, 2009).

Dolor leve o moderado, dismenorrea, tendinitis aguda o bursitis: inicial: 500 mg, después 500 mg cada 12 h, o 250 mg cada 6 a 8 h según sea necesario; dosis máxima: 1 250 mg/día inicialmente, en lo sucesivo 1 000 mg/día. (Taketomo, 2009).

Nota: no se recomienda la tableta de liberación retardada para el tratamiento del dolor agudo debido a que se retrasa su absorción. (Taketomo, 2009).

Ajuste de dosis en disfunción renal: disfunción moderada o grave ($D_{cr} < 30$ mL/min): no se recomienda su empleo. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Naproxéno, Acido Acetilsalicílico, otros aine o a cualquier componente de la formulación, dolor preoperatorio en caso de cirugía de injerto de derivación de arteria coronaria en EU. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Sustrato de las Isoenzimas CYP2C8 (5-hidroxilación), CYP2C9 (5-hidroxilación) y CYP2C18 del citocromo P450. (Taketomo, 2009).

El Naproxéno puede aumentar los niveles séricos de metotrexate y litio, y disminuir los efectos antihipertensivos de inhibidores de la ECA o antagonistas de angiotensina II, así como los efectos de otros agentes antihipertensivos, Furosemida y Tíacidas (vigilar la presión arterial). (Taketomo, 2009).

El uso concomitante de antiácidos, Sucralfato o Colestiramina puede retardar la absorción de Naproxéno (espaciar su administración 2 h). (Taketomo, 2009).

El empleo concomitante de bloqueadores H₂, Sucralfato o terapéutica antiácida Intensiva no es recomendable con tabletas de Naproxéno de liberación retardada (por los efectos de estos agentes sobre el pH gástrico). (Taketomo, 2009).

El Probenecid puede aumentar las concentraciones séricas de Naproxéno. Otros irritantes gastrointestinales (p. ej., Ácido Acetilsalicílico, alcohol, (AINE), Corticosteroides, complementos de potasio oral) pueden aumentar sus efectos adversos gastrointestinales. (Taketomo, 2009).



El uso con anticoagulantes (Warfarina, Heparina, HBPM) puede incrementar el riesgo de hemorragia. Por su elevada fijación a proteínas, es posible que ocurran interacciones de Naproxéno con otros fármacos que también se unen a éstas. (Taketomo, 2009).

Nota: Ibuprofeno y otros inhibidores de COX-1 pueden reducir el efecto cardioprotector (antiplaquetario) del Ácido Acetilsalicílico si se administran de forma concurrente. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: edema, hipertensión, palpitaciones. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: fatiga, estado soporoso, vértigo, cefalea, meningitis aséptica (< 1%). (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: prurito, exantema; seudoporfiria (es decir, aumento de la fragilidad de la piel y vesiculación con cicatrización en piel expuesta al sol), incidencia: 12% en niños con artritis reumatoide juvenil (ARJ) tratados con Naproxéno (suspender el tratamiento si ocurre); dermatitis exfoliativa, síndrome de Stevens-Johnson, necrólisis epidérmica tóxica. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: retención de líquidos. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: dolor abdominal, náusea, pirosis, constipación, vómito, hemorragia gastrointestinal, úlceras, perforación, diarrea, dispepsia, estomatitis. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: trombocitopenia, anemia, inhibición de la agregación plaquetaria, prolongación del tiempo de sangrado, agranulocitosis. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: elevación de enzimas hepáticas; rara vez: hepatitis, ictericia, necrosis hepática, insuficiencia hepática. (Taketomo, 2009).

Oculares: alteraciones visuales. (Taketomo, 2009).

Oticas: tinnitus. (Taketomo, 2009).

Renales: disfunción renal. (Taketomo, 2009).

Diversas: reacciones de hipersensibilidad, reacciones anafilactoides. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Los (AINE) se relacionan con incremento del riesgo de eventos trombóticos cardiovasculares, que incluyen infarto miocárdico (IM) y accidente vascular cerebral potencialmente mortales; el riesgo puede aumentar con la duración del uso, o factores de riesgo o enfermedades cardiovasculares; evaluar con cuidado el perfil de



- riesgo cardiovascular para prescribirlos; utilizar la dosis mínima efectiva por el periodo más corto con base en los objetivos de tratamiento del paciente en particular; deben considerarse terapéuticas alternativas en individuos con alto riesgo. (Taketomo, 2009).
- Se observó incremento de la incidencia de IM y accidente vascular cerebral en pacientes que reciben (AINE) selectivos COX-2 para tratamiento del dolor en el transcurso de 10 a 14 días después de cirugía de CPC. (Taketomo, 2009).
 - Los (AINE) pueden causar retención de líquidos, edema e hipertensión de nuevo inicio o agravamiento de la preexistente; usar con cautela en pacientes con hipertensión, insuficiencia cardíaca congestiva (ICC) o retención de líquidos; tener presente el contenido de sodio de los productos de Naproxéno sódico en pacientes con restricción de este elemento. (Taketomo, 2009).
 - Los (AINE) pueden aumentar el riesgo de irritación, ulceración, hemorragia y perforación gastrointestinales. Es posible que estos eventos, que pueden poner en riesgo la vida, ocurran en cualquier momento durante el tratamiento y sin advertencia. Emplear (AINE) con precaución extrema en pacientes con antecedente de hemorragia o úlceras gastrointestinales (tienen un riesgo 10 veces mayor de desarrollar hemorragia gastrointestinal). (Taketomo, 2009).
 - Utilizar (AINE) con cautela en individuos con otros factores de riesgo que pueden aumentar la hemorragia gastrointestinal (p. ej., terapéutica concomitante con ácido acetilsalicílico, anticoagulantes, corticosteroides o todos los anteriores, una duración más prolongada del uso de (AINE), tabaquismo, consumo de alcohol y mal estado general). Administrar la dosis mínima efectiva por el periodo más corto con base en los objetivos de tratamiento del paciente; deben considerarse terapéuticas alternativas en pacientes con alto riesgo. (Taketomo, 2009).
 - Los (AINE) pueden poner en riesgo la función renal. Es posible que experimenten toxicidad renal los pacientes con disfunción renal, deshidratación, depleción de sal, insuficiencia cardíaca, disfunción hepática, personas que toman diuréticos e inhibidores de la ECA; usar con cautela en estos pacientes; vigilar estrechamente la función renal. El Naproxéno se recomienda para pacientes con disfunción renal moderada o grave ($Cl_{cr} < 30$ mL/min). El uso prolongado de estos medicamentos puede causar necrosis papilar renal y otras lesiones renales. (Taketomo, 2009).

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenett.com

www.cegimed.org



- Individuos con la "tríada de la ácido acetilsalicílico" que reciben (AINE) podrían presentar reacciones asmáticas y anafilactoides. (Taketomo, 2009).
- Estos fármacos pueden causar reacciones adversas dermatológicas, incluyendo dermatitis exfoliativa, síndrome de Stevens-Johnson y necrólisis epidérmica tóxica. Evitar el uso de (AINE) al final del embarazo, porque pueden producir cierre prematuro del conducto arterioso. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Sobredosis:

Efectos Clínicos De La Sobredosis
Los siguientes efectos han sido seleccionados en base a su potencial significancia clínica posible signos:

Color azulado de las uñas, los labios o la piel, convulsiones, especialmente en niños, dificultad en la audición de sonido o zumbido en los oídos mareos o aturdimiento, alucinaciones, dolor de cabeza severo y permanente, aumento o disminución de la presión arterial náuseas, estado de ánimo o de metal, vómitos o dolor estomacal, edema severo, hinchazón alrededor de los ojos, dificultad para respirar o respiración inusualmente lenta, rápida o irregular, hinchazón de la

cara, manos, pies o piernas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento de sobredosis:

Para disminuir la absorción: vaciar el estómago a través de la inducción de la emesis (sólo en pacientes conscientes) o lavado gástrico. Sin embargo, el jarabe de Ipecacuana puede inducir síntomas similares a los de la toxicidad del Naproxéno, lo que puede complicar el diagnóstico, y no se recomienda para la inducción de la emesis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Administración de carbón vegetal activado.

La eficacia de carbón activado en la disminución de la absorción de estos medicamentos cuando se administran más de 2 horas después de la ingestión de la sobredosis no ha sido determinada.

Sin embargo, hay alguna evidencia de que la administración repetida de carbón activado, puede entrar en la circulación hepática y /o vincular algunos de los medicamentos que se ha difundido desde la circulación hacia el intestino, lo que aumenta la excreción no renal. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para mejorar la eliminación, la administración de antiácidos u otros alcalinizadores urinario puede aumentar excreción de Diflunisal o Sulindac. Los antiácidos pueden



aliviar los efectos adversos gastrointestinales. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La hemodiálisis puede ser necesaria para tratar la insuficiencia renal, pero no puede ser utilizada para disminuir las concentraciones plasmáticas de los (AINE) esto debido a su alto grado de unión a proteínas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

El tratamiento específico para hipotensión severa: usar de expansores de volumen. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para convulsiones: El Diazepam u otros Anticonvulsivantes o Benzodiazepinas apropiadas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para Hipoprotrombinemia: El uso de vitamina K. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Instituir un tratamiento de apoyo sintomático y otros según sea necesario. Ciertos efectos adversos de los (AINE), incluido el síndrome de nefritis o nefrítico, trombocitopenia, anemia hemolítica, y severas reacciones cutáneas de hipersensibilidad o de otro tipo, pueden responder a la administración de glucocorticoides. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Monitorización: debe considerarse que hay posibilidad de ulceración gastrointestinal o hemorragia, y discrasias sanguíneas, pueden aparecer varios días después de la ingestión de una sobredosis. Los pacientes pueden ser dados de alta después del tratamiento inicial, y deben ser informados de los posibles síntomas, y buscar tratamiento inmediato si se presentan. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 435
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1170-1171.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 92-93.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 915-916.



NEVIRAPINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Nevirapina.

FORMA FARMACEUTICA:

Suspensión oral.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

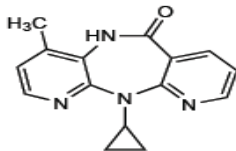
Nombre químico: 11-ciclopropil-5,11-dihidro-4-metil-6H-dipirido [3,2-b: 2',3'-f] [1,4] diazepin-6-ona. (Lacy, 2011).

Sinónimos: NVP o BIRG-587. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antirretroviral inhibidor de la transcriptasa inversa (no nucleósido). (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Tratamiento de infección por VIH en combinación con otros fármacos antirretrovirales (**Nota:** se recomiendan enfáticamente regímenes para VIH con **tres** antirretrovirales). No iniciar el tratamiento con Nevirapina en mujeres con recuentos de CD4+ > 250 células/mm³ ni en hombres con recuentos de CD4+ > 400 células/mm³, a menos que el beneficio sea mayor que el riesgo. La Nevirapina se usa también como quimioprofilaxia de transmisión materno-fetal del VIH. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Como un inhibidor no nucleosídico de transcriptasa inversa, Nevirapina tiene actividad contra VIH-1 al unirse a la transcriptasa inversa. Bloquea en consecuencia las actividades de la DNA polimerasa dependiente de RNA y de DNA que incluyen la replicación de VIH-1. No requiere fosforilación intracelular para su actividad antiviral. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

FARMACOCINÉTICA:



- **Absorción:** > 90%. (Martindale, 2009).
- **Distribución:** V_d : 1.21 L/Kg; se distribuye ampliamente; atraviesa la placenta; se excreta en la leche materna; se alcanza 45% de la concentración plasmática en líquido cefalorraquídeo. (Martindale, 2009)
- **Metabolismo:** metabolizada por isoenzimas del citocromo P450 de la familia CYP3A en metabolitos hidroxilados; ocurre autoinducción del metabolismo en dos a cuatro semanas con un aumento de 1.5 a 2 veces la depuración; la Nevirapina se metaboliza con más rapidez en pacientes pediátricos que en adultos. (Martindale, 2009)
- **Unión a proteínas:** plasma: 60%. (Martindale, 2009)
- **Biodisponibilidad:** 91 a 93%. (Martindale, 2009).
- **Vida media:** dosis única (45h); múltiples dosis (25 a 30 h). (Martindale, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** 4 h. (Martindale, 2009).
- **Eliminación:** 81.3% en orina como metabolitos. (Martindale, 2009). 10.1% en heces

< 3% de la dosis total se elimina en la orina como fármaco sin cambios.

- **Depuración:** la depuración en mujeres es 13.8% menor que en hombres; la dimensión corporal no explica del todo esta diferencia. (Martindale, 2009).

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Infección por VIH:

Lactantes \geq 15 días y niños: 150 mg/m² 1 vez/día durante los primeros 14 días (dosis máxima: 200 mg/día); incrementar la dosis a 150 mg/m² 2 veces/día si no hay exantema o efectos posteriores (dosis máxima: \leq 400 mg/día). Niños \leq 8 años de edad: pueden requerir 200 mg/m² 2 veces/día. (Lacy, 2011).

Adolescentes y adultos: inicial: 200 mg 1 vez/día durante los primeros 14 días; mantenimiento: 200 mg 2 veces/día (en combinación con un fármaco antirretroviral adicional) si no hay exantema u otros eventos adversos. (Lacy, 2011).

Nota: si el paciente presenta exantema durante el periodo de integración de 14 días, la dosis no debe incrementarse hasta que se resuelva el exantema. El periodo de integración no debe exceder de 28 días; el tratamiento alternativo debe considerarse en dicho momento.



Interrumpir si hay exantema intenso, exantema con síntomas constitucionales o exantema con elevación de las transaminasas hepáticas. Utilizar prednisona para prevenir el exantema relacionado con Nevirapina no se recomienda. Suspender de forma permanente si ocurren eventos hepáticos sintomáticos. Si el tratamiento se suspende por > 7 días, reiniciar con la dosis inicial durante 14 días. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: Hipersensibilidad a la Nevirapina o cualquier componente de la fórmula; disfunción hepática moderada o grave (Child-Pugh B o C). (Martindale, 2009).

Precauciones: Usar con cautela en pacientes con disfunción renal o hepática; no se recomienda para pacientes con disfunción hepática grave, antecedente de infección hepática crónica (B o C) o ambos; la Nevirapina puede acumularse en pacientes con disfunción hepática y ascitis. Se observa redistribución y acumulación de grasa [como obesidad central, adelgazamiento periférico y facial, aumento del volumen de las mamas, aumento de la grasa dorsocervical (giba de búfalo) y apariencia cushinoide] en quienes reciben agentes antirretrovirales. (Martindale, 2009).

Pueden presentarse síndrome de reconstitución inmunológica (una respuesta inflamatoria contra

infecciones residuales u oportunistas indolentes) en pacientes con VIH durante el tratamiento inicial con una combinación de agentes antirretrovirales, que incluyen Nevirapina; este síndrome podría requerir una valoración más profunda del paciente y tratamiento. (Martindale, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Interacciones con otros medicamentos y / o problemas relacionados:

Las siguientes interacciones con drogas y / o problemas relacionados han sido seleccionados sobre la base de su potencial significancia clínica. (Taketomo, 2009).

Nota: Las combinaciones que contengan cualquiera de los siguientes medicamentos, dependiendo de la cantidad presente, también puede interactuar con este medicamento. (Taketomo, 2009).

Cimetidina: El uso simultáneo de Nevirapina con Cimetidina, un conocido inhibidor de CYP3A, dio lugar a elevadas concentraciones en estado estacionario valle de Nevirapina cuando se estudió en un pequeño número de pacientes. . (Taketomo, 2009).

Los anticonceptivos que contienen estrógenos y, por vía oral:



La Nevirapina puede disminuir las concentraciones plasmáticas de los anticonceptivos orales debido a la inducción de CYP3A por Nevirapina, sin embargo, los estudios clínicos no se han realizado, el uso concurrente no se recomienda. . (Taketomo, 2009).

Didanosina, zalcitabina o Zidovudina:

Cambios farmacocinéticos clínicamente significativos, no se observaron cuando la Nevirapina fue administrado en combinación con Didanosina, Zalcitabina o Zidovudina, no se recomienda ajustar la dosis. (Taketomo, 2009).

Ketoconazol:

El uso concurrente con los resultados de Nevirapina en las concentraciones plasmáticas de ketoconazol redujo significativamente, el uso concurrente no se recomienda. (Taketomo, 2009).

Los antibióticos macrólidos:

El uso simultáneo de Nevirapina con antibióticos macrólidos, inhibidores conocidos de la CYP3A, mostraron elevaciones en estado estacionario las concentraciones valle de Nevirapina cuando se estudió en un pequeño número de pacientes. (Taketomo, 2009).

Inhibidores de la proteasa, tales como:

Indinavir, Ritonavir, Saquinavir. La Nevirapina reduce la concentración plasmática de Indinavir y Saquinavir, debido a la

inducción de las enzimas del citocromo P450, la importancia clínica de estas interacciones no se conoce, ajustar la dosis de estos medicamentos puede ser necesario. (Taketomo, 2009).

Rifabutina o Rifampicina:

La concentración plasmática de Nevirapina puede disminuir por Rifabutina o debido a la inducción de CYP3A Rifampicina, estos medicamentos deben utilizarse en combinación sólo si está claramente indicado y con un control cuidadoso. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central: cefalea, fiebre, sedación, malestar general. (Martindale, 2009).

Dermatológicas: exantema (por lo general erupciones cutáneas eritematosas maculopapulares con prurito o sin él, localizadas en tronco, cara y extremidades, las mujeres podrían tener más riesgo de desarrollarlo: 21% de los pacientes pediátricos presenta exantema), necrólisis epidérmica tóxica, angiedema, síndrome de Stevens-Johnson. (Martindale, 2009).

Endocrinas y metabólicas: redistribución y acumulación de grasa. (Martindale, 2009).

Gastrointestinales: náusea, diarrea, vómito, dolor abdominal. (Martindale, 2009).



Hematológicas: eosinofilia, neutropenia (niños, 8.9%), granulocitopenia [más común en niños más pequeños (2 semanas a < 3 meses de edad) en comparación con otros mayores o adultos. (Martindale, 2009).

Hepáticas: elevación de enzimas hepáticas, hepatotoxicidad (niños, 2.4%), insuficiencia hepática, hepatitis colestática, necrosis hepática, ictericia. (Martindale, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: mialgias, artralgias, parestesias. (Martindale, 2009).

Diversas: anafilaxia, reacciones de hipersensibilidad. (Martindale, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **B** (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Han ocurrido reacciones cutáneas graves y que ponen en peligro la vida (p.ej. síndrome de Stevens-Johnson, necrólisis epidérmica tóxica, y reacciones de hipersensibilidad caracterizadas por exantema y disfunción orgánica) en pacientes que reciben nevirapina. (Martindale, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas:

Se han reportado casos de sobredosis de Nevirapina entre 800 y 1800 mg por día durante un máximo de 15 días. Estos pacientes experimentaron edema, eritema nudoso, fatiga, fiebre, dolor de cabeza, insomnio, náuseas y vómitos, erupción cutánea, vértigo, y pérdida de peso. (Taketomo, 2009).

Tratamiento:

No hay antídoto conocido para la sobredosis de nevirapina. (Taketomo, 2009).

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un centro toxicológico. (Taketomo, 2009).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2190-2191.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1179,1188.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición).



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Inglaterra: Pharmaceutical Press.
Pp. 899

4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 927-929

NIFEDIPINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Nifedipina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas de liberación prologada.
Tabletas de liberación inmediata.

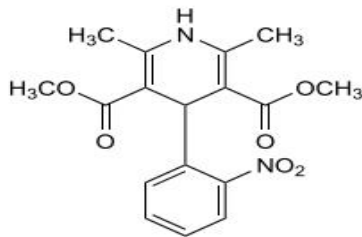
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

1,4-Dihidro-2,6-dimetil-4-(2-nitrofenil)-3,5-piridinadicarboxilato de dimetilo, Nifedipino.(Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antagonista de los canales de calcio; Bloqueador de canales de calcio; dihidropiridina.(Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Es un vasodilatador periférico y coronario, pero, a diferencia de los antagonistas del calcio como Verapamilo o Diltiazem, tiene muy poca o ningún efecto sobre la conducción cardiaca y rara vez se observa actividad inotropa negativa a dosis terapéuticas. La administración de Nifedipina provoca primariamente vasodilatación, con una resistencia periférica, presión arterial y una poscarga reducida, un flujo sanguíneo coronario aumentado y un incremento reflejo de la frecuencia cardiaca. Esto a su vez, provoca un aumento del suministro de oxígeno al miocardio y del gasto cardiaco.

La Nifedipina se utiliza en el tratamiento de la hipertensión; en la profilaxis de la angina de pecho, particularmente cuando esta presente un elemento vasospástico, como en la angina de Prinzmetal, y en el tratamiento del síndrome de Raynaud. Se ha aprobado también en numerosos trastornos no vasculares.(Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: inhibe la entrada de los iones calcio a los "canales lentos" o áreas selectas sensibles a voltaje del músculo liso



vascular y vasodilatación coronaria, lo que ocasiona relajación del musculo liso vascular coronario y vasodilatación coronaria; incrementa la liberación de oxígeno miocárdico en pacientes con angina vasospástica; también disminuye la resistencia vascular periférica, lo que provoca disminución de la presión arterial.(Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Inicio de Acción:** liberación inmediata en aproximadamente 20 minutos.(Lacy, 2011).
- **Absorción:** se absorbe rápida y casi totalmente en el tubo digestivo.(Lacy, 2011).
- **Biodisponibilidad:** capsulas: 40 a 77%; liberación sostenida: 65 a 89% en relación con las capsulas de liberación inmediata; la biodisponibilidad se incrementa con una enfermedad hepática significativa.(Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** se une aproximadamente en un 92% y 98% a proteínas plasmáticas.(Lacy, 2011).
- **Vida media:** eliminación: adultos: saludables: 2 a 5 horas; cirrosis: 7 horas; ancianos: 7 horas (tabletas de liberación prolongada).(Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático mediante CYP3A4.(Lacy, 2011).

- **Excreción:** en orina (60 a 80% como metabolitos inactivos); en heces.(Lacy, 2011).

DOSIS:

DOSIS ORAL

Adultos:

Nota: el ajuste de la dosis debe llevarse a cabo con intervalos de 7 a 14 días, para permitir una valoración adecuada de la nueva dosis; cuando se sustituye de formulaciones de liberación inmediata a liberación sostenida, utilizar la misma dosis diaria total.(Lacy, 2011).

Angina estable crónica o vasoespástica:

Liberación inmediata: inicial: 10 mg 3 veces/día; dosis usual: 10 a 20 mg 3 veces/día; máximo: 180 mg/día.

Nota: no utilizar para episodios de angina aguda; puede precipitar infarto miocárdico.(Lacy, 2011).

Liberación prolongada: inicial: 30 a 60 mg 1 vez/día; máximo: 120 a 180 mg/día.(Lacy, 2011).

Hipertensión:

Liberación prolongada: inicial: 30 a 60 mg 1 vez/día; máximo: 90 a 120 mg/día.(Lacy, 2011).

Niños: de 1 a 17 años:

Hipertensión: tabletas de liberación prolongada: inicial: 0.25 a 0.5 mg/Kg/día 1 vez/día o en 2 dosis



divididas; máximo 3 mg/Kg/día hasta 120 mg/día.(Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

hipersensibilidad a Nifedipina o a cualquier componente de la formulación; preparación de liberación inmediata para el tratamiento de urgencia o emergencia hipertensivas; MI agudo.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Precauciones: puede ocurrir hipotensión sintomática con o sin síncope en raras ocasiones, la presión arterial debe disminuirse a una velocidad apropiada para la condición clínica del paciente.(Lacy, 2011).

La disminución de la presión arterial debe realizarse a una velocidad adecuada para la condición del paciente. La disminución rápida de la presión arterial puede ocasionar insuficiencia arterial. Ha ocurrido incremento de la angina y/o MI con el inicio o incremento gradual de la dosis de antagonistas de los canales de calcio dihidropiridínicos; utilizar con precaución en pacientes con enfermedad coronaria obstructiva en especial en ausencia de bloqueo beta concurrente. Usar con cautela antes de cirugía mayor. La derivación cardiopulmonar, la pérdida intraoperatoria de sangre o las anestias vasodilatadoras pueden ocasionar hipotensión grave y/o incremento de los

requerimientos de líquidos. Considerar retirar Nifedipina (mayor a 36 horas) antes de la cirugía si es posible.(Lacy, 2011).

Emplear con cautela en HF o estenosis aortica grave (en especial con el uso concomitante de un bloqueador beta adrenérgico), disfunción ventricular izquierda grave, disfunción renal, cardiomiopatía hipertrófica (en especial obstructiva), tratamiento concomitante con bloqueadores beta o Digoxina y edema. Utilizar con precaución en pacientes con disfunción hepática grave (puede requerir ajuste de dosis). Las elevaciones transitorias y leves de las enzimas de funcionamiento hepático pueden ser aparentes durante las siguientes 8 semanas al inicio del tratamiento. La abstinencia abrupta puede ocasionar rebote de la angina en pacientes con CAD. Nifedipina de acción corta puede ser inapropiado para utilizarse en las personas de edad avanzada debido al potencial para ocasionar hipotensión y estreñimiento.

La formulación de liberación inmediata no debe utilizarse para manejar la hipertensión esencial, no se han llevado a cabo estudios para evaluar la evolución. Evitar el uso de tabletas de liberación prolongada en pacientes con estrechez o constricción del sistema gastrointestinal.(Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Anestésicos hidrocarburos inhalados: el uso concurrente con



los agentes bloqueadores de los canales de calcio pueden producir hipotensión aditiva, aunque los agentes bloqueadores de los canales de calcio pueden ser útiles para prevenir taquicardias supraventriculares, hipertensión arterial o espasmo coronario durante la cirugía, se recomienda precaución durante el uso. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Anti-inflamatorios no esteroideos y fármacos (AINE), especialmente indometacina: Indometacina y posiblemente otros AINE pueden antagonizar el efecto antihipertensivo de los agentes bloqueadores de los canales de calcio inhibiendo la síntesis de prostaglandinas renales y / o por causa de retención de sodio y de líquidos, el paciente debe ser cuidadosamente monitorizado para confirmar que el efecto deseado se obtiene. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Beta-adrenérgicos, sistémico u oftalmológico: el uso concomitante con dihidropiridinas, aunque por lo general es bien tolerado, puede producir una hipotensión excesiva, y en raros casos puede aumentar la posibilidad de insuficiencia cardíaca congestiva. En ocasiones, se ha producido angina de pecho al inicio de la terapia con Nifedipina, sobre todo después de la interrupción abrupta del reciente beta-adrenérgico. Sin embargo, si el uso concurrente con Nifedipina es necesario puede ser preferible

acomparación con otros agentes que bloquean los canales de calcio en algunos pacientes debido a que tiene menos efecto sobre la frecuencia cardíaca y la conducción. El uso concurrente de un agente de bloqueo del canal de calcio puede dar lugar a trastornos de la conducción auriculoventricular, insuficiencia ventricular izquierda e hipotensión. El uso concomitante de agentes bloqueadores del canal de calcio y agentes oftálmicos bloqueadores beta-adrenérgicos debe evitarse en pacientes con insuficiencia cardíaca. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Carbamazepina, ciclosporina, quinidina, teofilina, valproato: una reacción idiosincrásica se ha informado en la que se uso de forma concomitante Nifedipina y Quinidina, provocó una considerable reducción de las concentraciones séricas de Quinidina, se recomienda precaución cuando la terapia con Nifedipina se inicia o se suspende en un paciente estabilizado con quinidina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Cimetidina: El uso concomitante con agentes bloqueadores de los canales de calcio puede resultar en la acumulación de la cimetidina como resultado de la inhibición del metabolismo de primer paso. Precaución cuidadosa de la dosis de agentes bloqueadores de los canales de calcio se recomienda al inicio de la terapia en pacientes que reciben Cimetidina, Ranitidina y



Famotidina, no parecen afectar de forma significativa el metabolismo de agentes de bloqueo del canal de calcio.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Glucósidos digitálicos: el uso concomitante de Digoxina con agentes bloqueadores de los canales de calcio (especialmente Verapamilo y, en menor medida, Bepridil, Diltiazem y Nifedipina) se ha informado que pueden aumentar la concentración sérica de digoxina.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Disopiramida y Flecainida: Se recomienda precaución cuando se utiliza disopiramida al mismo tiempo con Nifedipina; También se recomienda precaución cuando se utiliza Flecainida conjuntamente con un agente bloqueador de los canales de calcio.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Estrógenos:La retención de líquidos inducida por los estrógenos tiende a aumentar la presión arterial, el paciente debe ser cuidadosamente monitoreado para confirmar que el efecto deseado está siendo obtenido.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Medicamentos altamente unidos a proteínas, tales como: anticoagulantes, cumarina, derivados de indandiona, los anticonvulsivantes, hidantoína,

medicamentos antiinflamatorios no esteroideos, quinidina, salicilatos, sulfinpirazona: se recomienda precaución cuando estos medicamentos se utilizan concomitantemente con Nifedipina.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Litio: el uso concomitante con agentes bloqueadores de canales de calcio puede resultar en neurotoxicidad en forma de náuseas, vómitos, diarrea, ataxia, temblores, y/o tinnitus, se recomienda precaución.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Otros medicamentos productores de hipotensión: los efectos antihipertensivos pueden ser potenciados cuando estos medicamentos se utilizan concomitantemente con agentes bloqueadores de los canales de calcio aunque algunos antihipertensivos y/o combinaciones de diuréticos se utilizan con frecuencia para obtener una ventaja, debe de realizarse un reajuste en la dosis.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Prazosina, y posiblemente otros agentes bloqueadores alfa-adrenérgicos: el uso concurrente con los agentes bloqueadores de los canales de calcio pueden producir un efecto hipotensor mayor, posiblemente relacionadas con el deterioro de las respuestas compensatorias de los alfa-



bloqueantes y/o inhibición del metabolismo de la Prazosina por agentes bloqueadores de los canales de calcio, se recomienda tener cuidado.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Procainamida o quinidina u otros medicamentos que causan prolongación del intervalo QT: riesgo de prolongación del aumento del intervalo QT, se recomienda precaución cuando se utiliza Procainamida o Quinidina con un agente bloqueador de los canales de calcio, ya que ambos grupos de medicamentos poseen propiedades inotrópicas negativas.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Rifampicina, y posiblemente otros inductores de enzimas hepáticas: algunos agentes que bloquean los canales de calcio pueden verse afectados, dependiendo del grado de metabolismo de primer paso.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Simpaticomiméticos: el uso concomitante puede reducir los efectos antihipertensivos de los agentes que bloquean los canales de calcio, el paciente debe ser cuidadosamente monitoreado para confirmar que el efecto deseado está siendo obtenido.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Valores de pruebas fisiológicas y de laboratorio:

Anticuerpos antinucleares (ANA) y test de Coombs, con o sin anemia hemolítica: han sido reportados resultados positivos durante la terapia de la Nifedipina.

La presión arterial puede reducirse con la utilización de agentes bloqueadores de los canales de calcio.

Enzimas hepáticas: raramente se puede aumentar después de varios días de tratamiento, las concentraciones deben volver a la normalidad tras finalizarla terapia.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: rubor, edema periférico, hipotensión, palpitaciones, taquicardia.(Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: mareo, cefalea, nerviosismo/cambios del estado de ánimo, fatiga, temblor intenso, desasosiego, alteraciones del sueño, alteraciones del equilibrio, fiebre, escalofríos.(Lacy, 2011).



Dermatológicas: dermatitis, prurito, urticaria. (Lacy, 2011).

Endocrinas y metabólicas: dificultades sexuales. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales: diarrea, estreñimiento, cólico, flatulencia, hiperplasia gingival. (Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: calambres musculares/fasciculaciones, debilidad, inflamación, rigidez articular. (Lacy, 2011).

Oculares: visión borrosa. (Lacy, 2011).

Respiratorias: tos/sibilancias, congestión nasal/ardor de garganta, congestión torácica, disnea. (Lacy, 2011).

Nota: se ha reportado casos en los que se presentan anomalías de la función hepática, incluyendo colestasis, debido a reacciones alérgicas. (Martindale, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: C. (Lacy, 2011).
- Lactancia: entra a la leche materna, no se recomienda. (Lacy, 2011).
- Interacciones con medicamentos: Las concentraciones séricas de Nifedipina pueden disminuir si se

administra con alimentos. Pueden ocurrir efectos colaterales vasodilatadores y terapéuticos incrementados, que incluyen hipotensión grave e isquemia miocárdica, si se administra Nifedipina a pacientes que ingieren toronjas. (Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

La gestión en una sobredosis de los bloqueadores del canal del calcio es principalmente de apoyo. Los efectos cardiovasculares generalmente predominan, y aunque la toxicidad severa es más común en sobredosis con los no dihidropiridinas tales como el Verapamil o Diltiazem, el tratamiento de sobredosis es similar para todos los bloqueadores de los canales de calcio. (Martindale, 2009).

Tratamiento para la intoxicación:

En caso de sobredosis (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007) (Lacy, 2011) intoxicación o intoxicación reciente (en un tiempo de 1 hora) con (Martindale, 2009) Nifedipina por vía oral puede hacerse un lavado de estómago; también se administra carbón adsorbente. Deben proporcionarse cuidados sintomáticos de soporte. La hipotensión responde a veces a la posición supina con los pies elevados y la administración de expansores del plasma, aunque hay que evitar la sobrecarga cardiaca. Si



la hipotensión persiste, tal vez sea necesaria la administración intravenosa de un simpaticomimético como Isoprenalina, Dopamina o Norepinefrina (Noradrenalina). La Bradicardia se trata con atropina, Isoprenalina o un marcapasos. La diálisis no es eficaz, pues el Nifedipina se conjuga en un grado elevado con las proteínas. La plasmaféresis puede ser beneficiosa.(Martindale, 2009).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 730-740.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp. Pp. 1196-1198.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp.1350-1357.



NIMODIPINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Nimodipina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

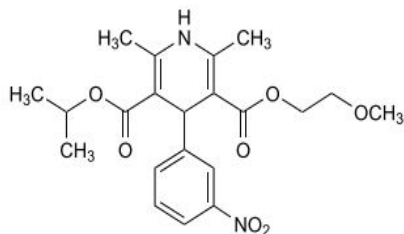
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

1,4-Dihidro-2,6-dimetil-4-(*m*-nitrofenil)-3,5-piridinadicarboxilato de isopropilo y 2-metoxietil; nimodipino.(Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antagonista de los canales de calcio; Bloqueador de canales de calcio; dihidropiridina.(Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Utilizado para vasoespasmos después de hemorragia subaracnoidea por aneurismas intracerebrales rotos.(Lacy, 2011).

Se emplea en trastornos cerebrovasculares, en especial en la prevención y el tratamiento de los déficits neurológicos isquémicos que siguen a las hemorragias subaracnoideas por aneurisma o por traumatismo.(Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Nimodipino comparte la farmacología de otros antagonistas de los canales de calcio; los estudios con animales indican que nimodipino tiene un mayor efecto en las arterias cerebrales que en otras arterias; esta especificidad incrementada puede deberse a la lipofilidad del fármaco y a la distribución cerebral en comparación con nifedipino; inhibe la entrada de los iones calcio a los "canales lentos" o áreas selectas sensibles a voltaje del músculo liso vascular y el miocardio durante la despolarización.(Lacy, 2011).



FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** se absorbe rápidamente por el tracto gastrointestinal después de la administración por vía oral. (Lacy, 2011).
- **Biodisponibilidad:** Esta informado que por vía oral es de un 13%. (Martindale, 2009).
- **Unión a proteínas:** mayor al 95%. (Lacy, 2011).
- **Vida media:** de eliminación es entre 1 a 2 horas; se prolonga con disfunción renal. (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático extenso. (Lacy, 2011).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** aproximadamente 1 hora. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** en orina (50%) y en heces (32%) en menos de 4 días. (Lacy, 2011).

DOSIS:

DOSIS ORAL

Adultos:

60 mg cada 4 horas durante 21 días, se debe de comenzar el tratamiento durante las siguientes 96 horas después de hemorragia subaracnoidea. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

hipersensibilidad a nimodipino o a cualquier componente de la formulación. (Lacy, 2011).

Precauciones: ha ocurrido incremento de la angina y/o MI al comenzar o incrementar de manera gradual la dosis de antagonistas de los canales de calcio. El efecto colateral más frecuente es el edema periférico; ocurre durante las primeras 2 a 3 semanas de iniciado el tratamiento. Puede ocurrir taquicardia refleja con su uso. Puede ocurrir hipotensión sintomática con o sin síncope en raras ocasiones; la presión arterial debe disminuirse a una velocidad adecuada la condición clínica del paciente.

Usar con cautela en disfunción hepática. Se ha informado pseudoobstrucción intestinal e íleo durante el uso de nifedipino. Emplear con precaución en pacientes con motilidad gastrointestinal disminuida o antecedentes de obstrucción intestinal.

Usar con cautela cuando se tratan pacientes con cardiomiopatía hipertrófica. No se han establecido la seguridad y la eficacia en niños. (Lacy, 2011).

El nimodipino debe administrarse con precaución en pacientes con



edema cerebral o presión intracraneal muy elevada.

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Anestésicos hidrocarburos inhalados: el uso concurrente con los agentes bloqueadores de los canales de calcio pueden ser útiles para prevenir taquicardias supraventriculares, hipertensión arterial o espasmo coronario durante la cirugía, se recomienda precaución durante el uso.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Anti-inflamatorios no esteroideos y fármacos (AINE), especialmente indometacina: indometacina y posiblemente otros AINEs pueden antagonizar el efecto antihipertensivo de los agentes bloqueadores de los canales de calcio inhibiendo la síntesis de prostaglandinas renales y / o por causa de retención de sodio y de líquidos, el paciente debe ser cuidadosamente monitorizado para confirmar que el efecto deseado se obtiene.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Beta-adrenérgicos, sistémico u oftalmológico:

El uso concurrente de un agente de bloqueo del canal de calcio puede dar lugar a trastornos de la conducción auriculoventricular, insuficiencia ventricular izquierda e hipotensión. El uso concomitante de agentes bloqueadores del canal de calcio y agentes oftálmicos

bloqueadores beta-adrenérgicos debe evitarse en pacientes con insuficiencia cardiaca.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Cimetidina: El uso concomitante con agentes bloqueadores de los canales de calcio puede ocasionar la acumulación de la cimetidina como resultado de la inhibición del metabolismo de primer paso. Tener precaución cuidadosa sobre la dosis de agentes bloqueadores de los canales de calcio se recomienda al inicio de la terapia en pacientes que reciben cimetidina, ranitidina y famotidina, no parecen afectar de forma significativa el metabolismo de agentes de bloqueo del canal de calcio.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Flecainida: Se recomienda precaución cuando se utiliza flecainida conjuntamente con un agente bloqueador de los canales de calcio.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Estrógenos:La retención de líquidos inducida por el estrógeno tiende a aumentar la presión arterial, el paciente debe ser cuidadosamente monitoreado para confirmar que el efecto deseado está siendo obtenido.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Otros medicamentos productores de hipotensión: los efectos



antihipertensivos pueden ser potenciados cuando estos medicamentos se utilizan concomitantemente con agentes bloqueadores de los canales de calcio, aunque algunos antihipertensivos y/o combinaciones de diuréticos se utilizan con frecuencia para obtener una ventaja terapéutica, debe de realizarse un reajuste en la dosis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Litio: el uso concomitante con agentes bloqueadores de canales de calcio puede resultar en neurotoxicidad en forma de náuseas, vómitos, diarrea, ataxia, temblores, y/o tinnitus, se recomienda precaución. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Prazosina, y posiblemente otros agentes bloqueadores alfa-adrenérgicos: el uso concurrente con los agentes bloqueadores de los canales de calcio pueden producir un efecto hipotensor mayor, posiblemente relacionadas con el deterioro de las respuestas compensatorias de los alfa-bloqueantes y/o inhibición del metabolismo de la prazosina por agentes bloqueadores de los canales de calcio, se recomienda tener cuidado. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Procainamida o quinidina u otros medicamentos que causan prolongación del intervalo QT: riesgo de prolongación en el

aumento del intervalo QT, se recomienda precaución cuando se utiliza procainamida o quinidina con un agente bloqueador de los canales de calcio, ya que ambos grupos de medicamentos poseen propiedades inotrópicas negativas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Rifampicina, y posiblemente otros inductores de enzimas hepáticas: algunos agentes que bloquean los canales de calcio puede verse afectados, dependiendo del grado de metabolismo de primer paso. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Simpaticomiméticos: el uso concomitante puede reducir los efectos antihipertensivos de los agentes que bloquean los canales de calcio, el paciente debe ser cuidadosamente monitoreado para confirmar que el efecto deseado está siendo obtenido. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Valores de pruebas fisiológicas y de laboratorio:

La presión arterial puede reducirse con la utilización de agentes bloqueadores de los canales de calcio. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Enzimas hepáticas: raramente se ven aumentadas después de varios días de tratamiento, las concentraciones deben volver a la normalidad tras finalizada la terapia.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: disminución de la presión arterial sistémica.(Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: cefalea.(Lacy, 2011).

Ha demostrado un incremento de 1.5 veces en la biodisponibilidad cuando se administra con jugo de toronja; evitar su uso concurrente.(Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación: entre los signos de efectos secundarios potenciales o síntomas se pueden indicar en especial angina de pecho, arritmias, insuficiencia cardíaca congestiva o edema pulmonar, edema periférico, taquicardia, bradicardia, hipotensión excesiva, agrandamiento gingival, reacción alérgica.

Tratamiento para la intoxicación:

Dermatológicas: exantema.(Lacy, 2011).

Gastrointestinales: diarrea, malestar abdominal.(Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo:C.(Lacy, 2011).
- Lactancia:entra en la leche materna, no se recomienda.(Lacy, 2011).
- Interacciones con alimentos: nimodipino ha

Para el tratamiento de los efectos adversos de sobredosis aguda: los siguientes tratamientos han demostrado ser eficaces para los efectos adversos que se indican:

- Hipotensión sintomática: líquidos por vía endovenosa. dopamina intravenosa o dobutamina, cloruro de calcio, isoproterenol, metaraminol o norepinefrina.
- Taquicardia, frecuencia ventricular rápida en pacientes con conducción anterógrada en fibrilación flutter auricular y vía accesoria con síndrome de Wolff-Parkinson-White o de Lown-Ganong-Levine: cardioversión con corriente directa o procainamida por vía intravenosa. líquidos por vía intravenosa administrados por goteo lento.



Bradycardia y rara vez bloqueo auriculoventricular de segundo o tercer grado (AV), en pacientes que progresan a asistolia: se le puede administrar atropina intravenosa, isoproterenol, noradrenalina, o cloruro de calcio o el uso de marcapasos electrónicos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 730-740.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp. Pp. 1200-1201.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1357-1358.

NISTATINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Nistatina.

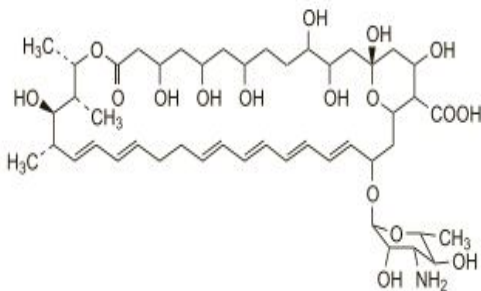
FORMA FARMACEUTICA:

Suspensión oral.
 Crema tópica.

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antimicótico.(Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Nistatina (suspensión oral): es utilizado para el tratamiento de infecciones micóticas cutáneas, mucocutáneas y de la cavidad oral por lo general causadas por especies de *Candida*.(Lacy, 2011).

Nistatina (crema tópica): tratamiento de infecciones micóticas cutáneas, mucocutáneas susceptibles por lo general causadas por especies *Candida*.(Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:se une a los esteroides en la membrana celular micótica, con lo que se cambia la permeabilidad de la pared celular y permite la fuga del contenido de la célula.(Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Inicio de Acción:**alivio sintomático para candidosis 24 a 72 horas.(Lacy, 2011).
- **Absorción:**se absorbe poco.(Lacy, 2011).
- **Excreción:**en heces (como fármaco sin cambio).(Lacy, 2011).

DOSIS:

DOSIS:
Nistatina (suspensión oral):

Lactantes prematuros: 100000 unidades 4 veces/día; pasar y



mantener la suspensión hacia los carrillos de la boca.(Lacy, 2011).

Lactantes: 200000 unidades 4 veces/día o 100000 unidades en cada lado de la boca 4 veces/día; pasar y mantener la suspensión hacia los carrillos de la boca.(Lacy, 2011).

Niños y adultos:400000 a 600000 unidades 4 veces/día; hacer buches en la boca y retener tanto tiempo como sea posible (varios minutos) antes de deglutir.(Lacy, 2011).

DOSIS:

Nistatina (crema tópica):

Infecciones mucocutáneas:

Niños y adultos:aplicar 2 a 3 veces/día sobre el área afectada; las lesiones tópicas muy húmedas se tratan mejor con polvo.(Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

hipersensibilidad a Nistatina o a cualquier componente de la formulación.(Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

En la forma oral debe evitarse tomar simultáneamente otros medicamentos que formen una película sobre la mucosa intestinal o que originen un aumento en las contracciones intestinales, ya que ello llevará a que la Nistatina esté menos tiempo en contacto con la

mucosa y por tanto su efecto será menor.

EFFECTOS ADVERSOS:

Nistatina (suspensión oral):

Gastrointestinales: diarrea, náusea, dolor estomacal, vómito.(Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo:C.(Lacy, 2011).
- Lactancia:se desconoce si se excreta en la leche materna, usar con cautela.(Lacy, 2011).
- La nistatina se puede confundir con inhibidores de la HMG-CoA reductasa (también conocidos como “estatinas”; por ejemplo Atorvastatina, Fluvastatina, Lovastatina, Pitavastatina, Pravastatina, Rosuvastatina, Simvastatina, etc).(Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Se han reportado náuseas y alteraciones gastrointestinales, en algunos casos de ingerir más de la cantidad debida. Dada la escasa absorción de este fármaco la posibilidad de intoxicación, incluso por ingestión accidental, es muy improbable. No



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



obstante, en caso de producirse, interrumpir el tratamiento e instaurar la terapia adecuada, de acuerdo con la sintomatología.

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp.Pp. 1203-1204.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 543-544.



NITAZOXANIDINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Nitazoxanidina.

FORMA FARMACEUTICA:

Cápsulas.

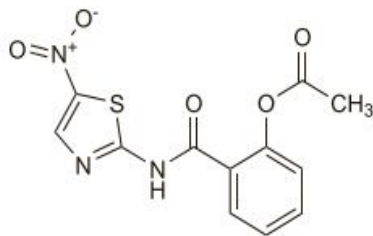
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Acetato de N-(5-nitro-2-tiazolil)salicilamida(éster).(Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antiprotozoario.(Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

La nitazoxanida se usa para el tratamiento de la criptosporidiosis y giardiasis en pacientes inmunocompetentes.(Martindale, 2009).

Tratamiento de diarrea causada por *Cryptosporidiumparvum* o *Giardialambli*a.(Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

Nitazoxanida se metaboliza con rapidez al metabolito activo tizoxanida in vivo. Su actividad puede deberse a interferencia con la reacción de transferencia de electrones dependientes de la enzima piruvato: ferredoxinaoxidoreductasa (PFOR), la cual es esencial para el metabolismo anaerobio. In vitro nitazoxanida y tizoxanida inhibe el crecimiento de los esporozoitos y ovoquistes de *Cryptosporidiumparvum* y trofozoitos de *Giardialambli*a.(Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:**se absorbe en el tracto gastrointestinal después de la administración por vía oral.(Martindale, 2009).
- **Biodisponibilidad:** biodisponibilidad relativa de la suspensión en comparación con las tabletas: 70%.(Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:**tizoxanida mayor a 99%.(Lacy, 2011).



- **Metabolismo:** hepático, a un metabolito activo, tizoxanida. Tizoxanida presenta conjugación para formar tizoxanidaglucurónido. Nitazoxanida no es detectable en el suero después de la administración oral.(Lacy, 2011).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** Tizoxanida y tizoxanidaglucurónido es de 1 a 4 horas.(Lacy, 2011).
- **Excreción:**tizoxanida en orina, bilis y heces; tizoxanidaglucurónido en orina y bilis.(Lacy, 2011).

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Niños:

1 a 3 años: 100 mg cada 12 horas durante 3 días.

4 a 11 años: 200 mg cada 12 horas durante 3 días.

12 o mayores a esta edad: 500 mg cada 12 horas durante 3 días.(Lacy, 2011).

Adultos:

500 mg cada 12 horas durante 3 días.(Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

hipersensibilidad a nitazoxanida o a cualquier componente de la formulación.(Lacy, 2011).

Precauciones: usar con cautela con pacientes con problemas renales o disfunción hepática. No se ha establecido la seguridad y la eficacia en niños con infecciones por VIH, inmunodeficiencia o en aquellos menores de 1 año de edad (suspensión) y menores de 12 años de edad (tabletas).(Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Anticoagulantes cumarínicos: El empleo con anticoagulantes cumarínicos puede incrementar los niveles plasmáticos de éstos y prolongar el tiempo de protrombina.

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central: cefalea, mareos, sudoración.(Martindale, 2009).

Gastrointestinales: dolor abdominal, diarrea, náusea, vómito.²

Dermatológicas: prurito.(Martindale, 2009).

Endocrinas y metabólicas: aumento del apetito, fiebre.(Martindale, 2009).

Renales: aumento de la creatinina.(Martindale, 2009).

Genitourinarias: cambios en la coloración de la orina.



ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: B.²
- Lactancia: se desconoce si se excreta en la leche materna, usar con cautela.²
- Consideraciones dietéticas: debe de administrarse con alimentos.²

2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 842-843.

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación: en caso de sobredosis se observa exacerbación de las reacciones adversas, en especial del aparato digestivo.

Tratamiento para la intoxicación: Puede inducirse el vómito y administrarse antiácidos de hidróxido de aluminio con magnesio.

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp. Pp. 1204-1205.



NITRATO DE MICONAZOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Nitrato de Miconazol.

FORMA FARMACEUTICA:

Crema tópica.
Crema vaginal.
Óvulos.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

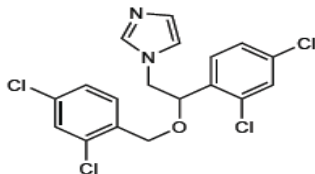
Nombre químico: 1 - [2,4-dicloro- β -(2,4-diclorobenciloxi) fenetilo] imidazol. (Martindale, 2009).

Sinónimos: Nitrato de Miconazol. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antimicótico tópico; Agente antimicótico vaginal. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



INDICACIONES:

El Miconazol es un antimicótico imidazólico que se aplica en forma de Nitrato de Miconazol o de base para el Tratamiento de candidiasis vulvovaginal y una variedad de infecciones micóticas de piel y membranas mucosas. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Inhibe la biosíntesis de Ergosterol, lo que daña la membrana de la pared celular del hongo, y con ello incrementa la permeabilidad y provoca fuga de nutrientes. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** tópica: insignificante. (Lacy, 2011).
- **Distribución:** en tejidos corporales, articulaciones y líquidos; penetra poco a esputo, saliva, orina y líquido cefalorraquídeo. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:** 91 a 93%. (Taketomo, 2009).

Fuente: Martindale 2009

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenett.com

www.cegimed.org



- **Metabolismo:** hepático.
(Taketomo, 2009).
- **Vida media:** degradación multifásica:
 - Alfa: 40 min
 - Beta: 126 min
 - Terminal: 24 h
- **Eliminación:** aproximadamente 50% se excreta en las heces y < 1% en la orina como fármaco sin modificar. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

TÓPICO:

- **Niños y adultos:** Nota: no utilizar como OTC en niños < 2 años:

Tiña corporal: aplicar 2 veces/día durante 4 semanas. (Lacy, 2011).

Tiña de los pies: aplicar 2 veces/día durante 4 semanas. (Lacy, 2011).

Tiña crural: aplicar 2 veces/día durante 2 semanas. (Lacy, 2011).

VAGINAL:

- **Niños \geq 12 años y adultos:** candidiasis vulvovaginal:

Crema, 2%: insertar 1 aplicador lleno a la hora de dormir durante 7 días. (Lacy, 2011).

OVULOS 400 mg:

- 1 óvulo al acostarse durante tres días, en casos muy graves el tratamiento puede alargarse hasta a 6 días, según el criterio del médico, o bien un óvulo diariamente durante dos semanas. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Miconazol o a cualquier componente de la formulación. (Lacy, 2011).

Precauciones: Usar con cautela en pacientes alérgicos a otros antimicóticos derivados de Imidazol (p.ej., Clotrimazol, Econazol. Ketoconazol). (Taketomo, 2009).

El Miconazol se considera un fármaco peligroso para los pacientes con porfiria debido a que en sistemas *in vitro* se ha demostrado que es porfirinógeno. (Martindale, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

El Miconazol puede inhibir el metabolismo de los fármacos metabolizados por las isoenzimas CYP3A4 y CYP2C9 del citromo P450 y tiene, por tanto, efectos similares a los del fluconazol. (Martindale, 2009).



El Miconazol incrementa los efectos de los anticoagulantes orales, las Sulfonilureas y la Fenitoína. Se han descrito efectos secundarios cuando se administra Miconazol y Carbamazepina al mismo tiempo. (Martindale, 2009).

Debe evitarse el empleo de las combinaciones de Miconazol con Astemizol, Cisaprida o Terfenadina, debido al riesgo de arritmias cardíacas. (Martindale, 2009).

Anticoagulantes: la actividad anticoagulante de los cumarínicos puede potenciarse mediante la administración oral o intravaginal de miconazol. (Martindale, 2009).

Incremento del efecto y la toxicidad: puede aumentar los niveles y efectos de: antagonistas de la vitamina K. (Taketomo, 2009).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

- A la fecha no se han reportado. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

La frecuencia no se ha definido.

Tópicas: dermatitis alérgica por contacto, ardor, maceración. (Lacy, 2011).

Vaginales: cólico abdominal, ardor, irritación, comezón. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: C. (Lacy, 2011).
- Lactancia: se desconoce si se excreta en la leche materna/usar con cautela. (Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Sobredosis: No se tiene experiencia a este respecto, por lo que no se han precisado cuáles son los síntomas, signos y tratamiento. En caso de ingestión accidental, se deberá inducir el vómito y vigilar al paciente e hidratarlo adecuadamente. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 334.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1117.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 541-542.



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 882.



NITROFURANTOINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Nitrofurantoína.

FORMA FARMACEUTICA:

Suspensión oral.
Tabletas.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

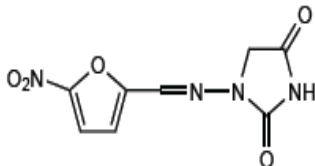
Nombre químico: 1-(5-Nitrofurfurylideneamino) Hidantoína; 1-(5-Nitrofurfurylideneamino)imidazolidina-2,4-diona. (Lacy, 2011).

Sinónimos: Furadantina. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antibiótico, diversos. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.
Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905
cegimed@intenett.com www.cegimed.org

INDICACIONES:

Prevención y tratamiento de infecciones de vías urinarias por microorganismos gramnegativos y algunos grampositivos sensibles, inclusive *E. coli*, *Klebsiella*, *enterobacter*, enterococos *S. saprophyticus* y *S. aureus*; *Pseudomonas*, *Serratia* y casi todas las especies de *Proteus* suelen ser resistentes a nitrofurantoína. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Inhibe varios sistemas enzimáticos bacterianos, entre ellos el de acetilcoenzima A; las enzimas bacterianas las reducen en intermediarios activos que pueden alterar las proteínas ribosómicas y producir inhibición de la síntesis de proteínas, ADN, ARN y pared celular. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** se absorbe bien en el tubo gastrointestinal; la forma macrocristalina se absorbe con mayor lentitud por disolución más lenta, pero causa menos molestias gastrointestinales que las presentaciones que contienen



el fármaco en microcristales.
(Taketomo, 2009).

- **Distribución:** V_d : **0.8 L/kg**; atraviesa la placenta; aparece en la leche materna y bilis. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:** aproximadamente 40 a 60%. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** parcial en el hígado. (Taketomo, 2009).
- **Biodisponibilidad:** se incrementa con la presencia de alimento. (Taketomo, 2009).
- **Vida media:** 20 a 60 min y se prolonga en disfunción renal. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** como metabolitos y fármaco sin modificar (40%) en la orina y cantidades pequeñas en la bilis; la excreción renal ocurre por filtración glomerular y secreción tubular. (Taketomo, 2009).
- **Diálisis:** es dializable. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Niños > 1 mes:

Tratamiento de UTI (infecciones de vías urinarias): 5 a 7 mg/kg/día en dosis divididas cada 6 h; máximo: 400 mg/día. Administrar durante 7 días o por lo menos 3 días después

de obtener orina estéril. (Lacy, 2011).

Profilaxis de UTI: 1 a 2 mg/kg/día en dosis divididas cada 12 a 24 h; máximo: 100 mg/día. (Lacy, 2011).

Niños > 12 años: tratamiento de UTI: 100 mg 2 veces/día durante 7 días.

Adultos:

Tratamiento de UTI: 50 a 100 mg/dosis cada 6 h; administrar durante 7 días o por lo menos 3 días después de obtener orina estéril. (Lacy, 2011).

Profilaxis de UTI: 50 a 100 mg/dosis a la hora de dormir. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Nitrofurantoína o cualquier componente de la fórmula; anuria, oliguria o disfunción renal significativa; neonatos; pacientes embarazadas hacia el término (38 a 42 SDG); durante el trabajo de parto y el parto (por el riesgo de anemia hemolítica); pacientes con antecedentes de ictericia colestásica o disfunción con el uso previo del fármaco. (Taketomo, 2009).

Precauciones: Usar con cautela en pacientes con deficiencia de G6PD (la anemia hemolítica inducida por Nitrofurantoína parece guardar un vínculo con la deficiencia de G6PD



eritrocitaria), pacientes con anemia, deficiencia de vitamina B, diabetes mellitus o anormalidades electrolíticas. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Interacciones con otros medicamentos y / o problemas relacionados:

Las siguientes interacciones con drogas y / o problemas relacionados han sido seleccionados sobre la base de su potencial significancia clínica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: Las combinaciones que contengan cualquiera de los siguientes medicamentos, dependiendo de la cantidad presente, también puede interactuar con este medicamento. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Hemolíticos:

El uso concurrente con Nitrofurantoína puede aumentar el potencial de efectos secundarios tóxicos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Medicamentos Hepatotóxicos:

El uso concurrente de Nitrofurantoína con otros medicamentos hepatotóxicos puede aumentar el riesgo de hepatotoxicidad. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Trisilicato de Magnesio:

El Trisilicato de magnesio reduce tanto la velocidad y el grado de absorción de Nitrofurantoína, probablemente por adsorción de Nitrofurantoína a su superficie. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Ácido Nalidíxico:

Nitrofurantoína interfiere con los efectos terapéuticos de ácido nalidíxico. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Medicamentos Neurotóxicos:

El uso concurrente de Nitrofurantoína con otros medicamentos neurotóxicos puede aumentar el riesgo de neurotoxicidad. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Probenecid o Sulfinpirazona:

Estos medicamentos pueden inhibir la secreción tubular renal de Nitrofurantoína, resultando en aumento de las concentraciones séricas y / o toxicidad, eliminación prolongada vida media y la reducción de las concentraciones urinarias y la eficacia, ajustar la dosis de Probenecid puede ser necesario. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Alteraciones de laboratorio:

Los siguientes han sido



seleccionados sobre la base de su potencial significancia clínica:

Resultados de pruebas de diagnóstico:

Glucosa en orina: la Nitrofurantoína puede producir metabolitos en la orina que puede dar resultados falsos positivos con la prueba de reducción de Sulfato de Cobre, tales como la solución de Benedict o solución de Fehling, y no interfiere con la prueba de glucosa enzimática. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: dolor torácico, cianosis, cambios en el ECG (relacionados con toxicidad pulmonar). (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: mareo, cefalea, escalofrío, fiebre, vértigo, estado soporoso, malestar general, seudotumor cerebral, confusión, depresión, reacciones psicóticas. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: exantema, dermatitis exfoliativa, urticaria, prurito, alopecia, síndrome de Stevens-Johnson, angioedema, eritema multiforme. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: hiperfosfatemia. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, vómito, anorexia, pancreatitis, colitis pseudomembranosa (rara), diarrea, dolor abdominal, flatulencia, dispepsia, constipación. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: anemia hemolítica, eosinofilia, leucopenia, granulocitopenia, trombocitopenia, anemia megaloblástica, metahemoglobinemia, anemia aplásica, reducción de hemoglobina. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: hepatotoxicidad, ictericia colestática, hepatitis, elevación de AST, ALT y fosfatasa alcalina. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y musculoesqueléticas: artralgias, neuropatía periférica, debilidad muscular, astenia, parestesias, mialgias. (Taketomo, 2009).

Oculares: neuritis óptica (rara), ambliopía, nistagmo. (Taketomo, 2009).

Respiratorias: neumonitis intersticial, fibrosis o ambas, disnea, tos. (Taketomo, 2009).

Diversas: reacciones de hipersensibilidad, síndrome similar a lupus, anafilaxia. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **B**. (Lacy, 2011).



- Alimentos: las concentraciones séricas de Nitrofurantoína pueden incrementarse si se administra con alimentos. (Lacy, 2011).
- Usar con cautela si se anticipa su tratamiento prolongado debido a posible toxicidad pulmonar. (Lacy, 2011).
- La Nitrofurantoína no debe utilizarse para tratar IVU en neonatos o lactantes con fiebre, así como en niños pequeños en quienes podría existir afectación renal. (Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un Centro de Control de Envenenamientos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento: El tratamiento recomendado consiste en lo siguiente:

Inducir el vómito para disminuir la absorción, mantener el tratamiento específico de una ingestión abundante de líquidos para promover la excreción urinaria de Nitrofurantoína. La Nitrofurantoína se puede eliminar de la circulación por medio de diálisis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Los pacientes en los que se sabe o se sospecha de una sobredosis intencional deben ser referidos para consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2220-2222.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1205-1207.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 941-942.



NORFLOXACINA DCL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Norfloxacin.

FORMA FARMACEUTICA:

Comprimido recubierto.
Tableta Recubierta Simple.

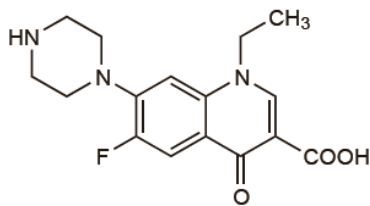
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Acido 1-etil-6-fluoruro-1,4-dihidro-4-oxo -7- (piperazinil) -3-quinolinacarboxilico (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antibiótico quinolonico. (Martindale, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Infecciones complicadas y no complicadas de vías urinarias causadas por bacterias Gramnegativas y Grampositivas susceptibles enfermedades de transmisión sexual (ej. Gonorrea uretral o cervicouterina no complicada) causada por N. gonorrhoeae, prostatitis debida a E. coli. (Martindale, 2009).

NOTA: desde abril de 2007, los CDC ya no recomiendan el uso de fluoroquinolonas para el tratamiento de enfermedades gonococias. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

Bactericida:
Las fluoroquinolonas actúan de manera intracelular por inhibición de la topoisomerasa II (ADN girasa) y / o la topoisomerasa IV. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007)..

Las topoisomerasas son enzimas bacterianas esenciales ya que son catalizadores críticos en la duplicación, transcripción y reparación del ADN bacteriano. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



FARMACOCINÉTICA:

• **Distribución:**

Las Fluoroquinolonas se distribuyen ampliamente en los fluidos corporales y tejidos, se concentra en hígado, riñones, vesícula biliar, tejido ginecológico, tejido prostático, células fagocíticas, esputo, orina y bilis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS:

INTERVALO USUAL DE DOSIFICACIÓN:

Adultos: oral: 400 mg cada 12 h (máximo: 800 mg/día) (Lacy, 2011)..

Dosis con indicación específica:

Adultos: oral:

Enterocolitis disintérica (Shigella, uso no autorizado) 400 mg 2 veces/día durante 5 días (Lacy, 2011)..

Prostatitis: 400 mg cada 12 h durante 4 a 6 semanas 2 veces/día durante 3 días, la dosis única también puede ser eficaz. (Lacy, 2011).

Gonorrea no complicada: 800 mg como dosis única. (Lacy, 2011).

Nota: desde abril de 2007 los CDC ya no recomiendan el uso de fluoroquinolonas para el tratamiento de gonorrea no complicada. (Lacy, 2011)..

Infecciones de vías urinarias:

No complicadas debida a E. coli, K. Pneumoniae, p. mirabilis: 400 mg, 2 veces/día durante 3 días. (Lacy, 2011).

No complicadas debidas a otros microorganismos 400 mg 2 veces/día durante 7 a 10 días. (Lacy, 2011)..

Complicadas: 400 mg 2 veces/día durante 10 a 21 días. (Lacy, 2011).

Intervalo de dosis en disfunción renal: Clcr \leq 30 mL/min/1.73 m²; suministrar 400 mg cada 24 h. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Las interacciones medicamentosas siguientes o problemas relacionados con Norfloxacin han sido seleccionados en base a su importancia clínica potencial. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

NOTA: la combinación que contiene cualquiera de los siguientes medicamentos, depende de la cantidad presente, también puede interactuar con la medicación. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Alcalinizadores urinarios, tales como:

- Inhibidores de la anhidrasa carbónica
- Citratos
- Bicarbonato de sodio



(Los alcalinizadores de la orina pueden reducir la solubilidad de Norfloxacin en el orina: Los pacientes deben ser observados para detectar signos de cristaluria y nefrotoxicidad, aunque la incidencia es poco frecuente). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La norfloxacin tiene interacciones con:

Aminofilina, Oxitriptilina, Teofilina
Amiodarona, Antidepresivos,
triciclicos, Astemizol, Bepredil,
Cisapride, Disopiramida,
Eritromicina, Pentamidina,
Fenotiazinas, Procaïn amida,
Quinidina, Sotalol, Tefenadine,
Antiácidos, Aluminio, Calcio, o
Magnesio que contenga Sulfato
Ferroso, Laxantes de magnesio que
contengan Sucralfato o Zinc,
Fenitoína, Insulina, AINE, Bismuto,
Cafeína, Didanosina, Digoxina,
Probenecid, Warfarina. (Drug
Information for the Health Care
Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

La relativa insolubilidad de Norfloxacin a un pH alcalino ha resultado en cristaluria, por lo general cuando el pH urinario es superior a 7. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Ya que el pH urinario normal es ácido, aproximadamente de 5 a 6, la cristaluria es muy poco probable que ocurra a menos que la orina de

los pacientes se ha convertido en alcalina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Situaciones en que necesitan atención médica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Son de escasa incidencia:

- Artralgia (dolor articular): estimulación del SNC (psicosis aguda, agitación, confusión, temblores alucinaciones, reacciones cardiovasculares tales como (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007)..
- Palpitaciones (latido del corazón rápido o irregular). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Vasodilatación (vértigos de desfallecimiento). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Elevación de la temperatura calor. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Enrojecimiento de la piel, especialmente en la cara y cuello. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Dolor de cabeza. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



- Mareos, sudoración. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Debilidad, o taquicardia (desmayos, latido del corazón rápido, fuerte, o pulso irregular). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Hematuria (sangre en la orina). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Hepatotoxicidad (orina de color oscuro o ámbar. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Pérdida de apetito. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Heces de color claro. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Estómago dolor. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Cansancio o debilidad inusual, ojos o piel amarillentos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Reacciones hipersensibilidad (erupciones en la piel, ictericia o enrojecimiento). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Síndrome de Stevens-Johnson, falta de aliento. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Hinchazón de la cara o el cuello, vasculitis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Nefritis intersticial (orina con sangre o turbia, fiebre, erupción cutánea, hinchazón de los pies de las extremidades inferiores). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Colitis pseudomembranosa (calambres abdominales o estomacales y dolor, sensibilidad abdominal intensa, diarrea acuosa y severa, que también pueden provocar fiebre sangrienta). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Tendinitis o de ruptura del tendón (dolor en clavos, se irradia a los talones, hinchazón de las pantorrillas o las piernas). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Tratamiento De Sobredosis:

Debido a que no existe un antídoto específico para la sobredosis de antibióticos Fluoroquinolónicos, el



tratamiento debe ser sintomático y de soporte. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para disminuir la absorción La inducción del vómito o realizar un lavado gástrico para vaciar el estómago. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 1528-1540.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1214-1215.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1214-1215.



OFLOXACINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Ofloxacina.

FORMA FARMACEUTICA:

Oftálmica.
Tabletas recubiertas simples.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

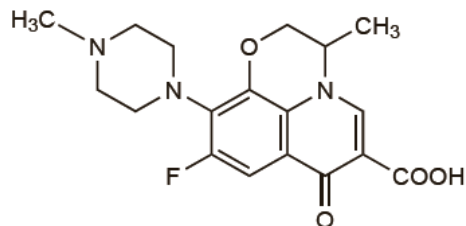
Ácido (\pm)-9-fluoro-2, 3-dihidro-3-metil-10-(4-metil-1-piperazinil)-7-oxo-7H-pirido [1,2,3-de]-1, 4-benzoxazino-6-carboxílico. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Sinónimos:
Ofloxacina. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antibiótico; Antibiótico Quinolónico; Antibiótico Ótico. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento de exacerbaciones bacterianas agudas de bronquitis crónica, neumonía adquirida en la comunidad, infecciones no complicadas de piel y estructuras cutáneas, gonorrea uretral y cervical (aguda, no complicada), uretritis y cervicitis (no gonocócicas), enfermedad pélvica inflamatoria, cistitis no complicada, infecciones de vías urinarias complicadas y prostatitis debidas a microorganismos sensibles, incluyendo *S. pneumoniae*, *S. aureus*, *S. pyogenes*, *C. koseri*, *E. aerogenes*, *E. coli*, *H. influenzae*, *K. pneumoniae*, *N. gonorrhoeae*, *P. mirabūis*, *C. trachomatis*, y *P. aeruginosa*. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de Acción:

Ofloxacina es un inhibidor de la ADN girasa. La ADN girasa es una enzima bacteriana esencial que mantiene la estructura súper helicoidal del ADN. La ADN girasa es necesaria para la replicación y transcripción de ADN, su reparación, recombinación y transposición bactericida. (Lacy, 2011).



FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** se absorbe bien. (Taketomo, 2009).
- **Distribución:** se distribuye ampliamente en todos los tejidos y fluidos, incluyendo los de vesículas, cérvix, pulmones, ovarios, tejido prostático, piel y esputo; atraviesa la placenta; se excreta en la leche materna. (Taketomo, 2009).
- **Vd** : 2.4 a 3.5 L/kg. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:** 20 a 32%. (Taketomo, 2009).
- **Biodisponibilidad:** 98%. (Taketomo, 2009).
- **Vida media, bifásica:** 4 a 7.4 h y 20 a 25 h; se prolonga en disfunción renal. (Taketomo, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** 1 a 2 h. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** 68 a 90% se excreta sin cambios en orina; 4 a 8% se excreta en heces; < 10% se metaboliza. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

OFTÁLMICA:

Lactantes > 1 año hasta adultos:

Conjuntivitis: aplicar una o dos gotas en el ojo afectado cada 2 a 4 h mientras se esté despierto durante los primeros dos días, y luego cuatro veces/día durante cinco días adicionales. (Taketomo, 2009).

Úlcera corneal: aplicar una o dos gotas en el ojo afectado cada 30 min mientras se esté despierto y cada 4 a 6 h durante la noche durante los primeros dos días; luego, a partir del día 3, aplicar una o dos gotas cada hora mientras se esté despierto durante 4 a 6 días adicionales; a partir de entonces, una o dos gotas cuatro veces/día hasta que se logre la curación clínica. (Taketomo, 2009).

ORAL

Nota:

Existe información limitada en relación con el uso de Ofloxacina en pacientes pediátricos; algunos centros recomiendan dosis de 15 mg/kg/día, divididos cada 12 h. (Taketomo, 2009).

ADULTOS:

Bronquitis crónica (exacerbación aguda), neumonía adquirida en la comunidad, infecciones en piel y estructuras cutáneas (no complicadas): 400 mg cada 12 h por 10 días. (Taketomo, 2009).



Gonorrea uretral y cervical (aguda, no complicada): 400 mg como dosis única Cervicitis o uretritis por *C. trachomatis* o infecciones mixtas por *C. trachomatis* y *N. gonorrhoeae*: 300 mg cada 12 h por 7 días. (Taketomo, 2009).

Enfermedad pélvica inflamatoria: 400 mg cada 12 h por 10 a 14 días
Cistitis (no complicada): 200 mg cada 12 h por 3 a 7 días UTI (complicada): 200 mg cada 12 h por 10 días. (Taketomo, 2009).

Prostatitis: 300 mg cada 12 h por 6 semanas. (Taketomo, 2009).

Ajuste de dosis en disfunción renal: adultos:
Dc r 20 a 50 mL/min: administrar la dosis usual cada 24 h. (Taketomo, 2009).

Dc r < 20 mL/min: administrar la mitad de la dosis usual cada 24 h. (Taketomo, 2009).

Ajuste de dosis en disfunción hepática: disfunción grave: dosis máxima: 400 mg/día. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Hipersensibilidad a Ofloxacin o a otros miembros del grupo de las quinolonas, como ácido Oxolínico, Cinoxacin, Norfloxacin y Ciprofloxacina, hipersensibilidad a cualquier componente de la formulación. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Inhibidor de la isoenzima CYP1A2 del citocromo P450. (Taketomo, 2009).

Puede modificar las concentraciones de glucosa en sangre en pacientes con diabetes que reciben en forma concomitante medicamentos Hipoglucemiantes (Taketomo, 2009).

Su uso concomitante con Corticosteroides puede incrementar el riesgo de rotura tendinosa. Puede aumentar los niveles séricos de Ciclosporina, Teofilina, Metilxantinas, Warfarina y Gliburida. (Taketomo, 2009).

El Probenecid puede aumentar los niveles de Ofloxacin. Su absorción disminuye con antiácidos que contienen Aluminio, Magnesio, Calcio, Sucralfato, cationes metálicos (es decir, Zinc, Hierro, Cobre, Magnesio), y Didanosina. (Taketomo, 2009).

Su uso concomitante a Fosfocarnet o (AINE) puede incrementar el riesgo de estimulación del SNC y convulsiones. (Taketomo, 2009).

Su uso concomitante a otros agentes que prolongan el intervalo QTC puede causar arritmias. (Taketomo, 2009).



EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: Insuficiencia cardiaca, hipertensión, hipotensión, bradicardia, taquicardia, edema, *torsade des pointes* (rara), prolongación del intervalo QT, dolor torácico. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: Mareo, sensación de inestabilidad, vértigo, insomnio (más común con Ofloxacin que con otras Quinolonas), fiebre, cefalea, hipertensión intracraneal, convulsiones, fatiga, nerviosismo, inquietud, confusión, alucinaciones, ansiedad, ideación suicida, depresión, encefalopatía, anomalías en el EEG. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: exantema, prurito, síndrome de Stevens-Johnson, fotosensibilidad, urticaria, angioedema, necrólisis epidérmica tóxica, eritema multiforme. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: hipoglucemia, hiperglucemia, anomalías electrolíticas. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: sabor amargo, náusea, vómito, diarrea, constipación, anorexia, dolor abdominal, colitis pseudomembranosa, pancreatitis. (Taketomo, 2009).

Genitourinarias: vaginitis. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: granulocitopenia, leucopenia, trombocitopenia, anemia hemolítica. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: elevación de enzimas hepáticas, insuficiencia hepática, ictericia. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: temblor, artralgias, tendinitis, rotura tendinosa, mialgias, neuropatía periférica. (Taketomo, 2009).

Oculares: solución oftálmica: sensación ardorosa o punzante, prurito, sensación de cuerpo extraño, hiperemia conjuntival, edema oftálmico, fotofobia, visión borrosa. (Taketomo, 2009).

Oticas: solución ótica: otalgia, tinnitus, otorragia. (Taketomo, 2009).

Renales: nefritis intersticial, insuficiencia renal aguda, hematuria. (Taketomo, 2009).

Respiratorias: broncoespasmo, dificultad respiratoria, disnea. (Taketomo, 2009).

Diversas: anafilaxia, enfermedad del suero. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

La formulación oral no se recomienda para uso en < 18 años; la Ofloxacin causa osteocondritis en ratas y perros inmaduros. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Las Fluoroquinolonas causan artropatía con erosiones del cartílago en articulaciones que sostienen peso en animales inmaduros; se han informado tendinitis aquilea y rotura tendinosa con uso de Fluoroquinolona, con mayor riesgo en pacientes que utilizan Corticosteroides de forma concomitante; su uso prolongado puede inducir sobreinfección; se pueden presentar estimulación al SNC e hipertensión intracraneal que se manifiesta como temblor, inquietud, confusión y, en raras ocasiones, alucinaciones, depresión, pesadillas, ideación suicida o convulsiones motoras; se han reportado también reacciones graves y fatales de hipersensibilidad o de tipo anafiláctico con la primera dosis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Si esto ocurre y no es fatal, suspender la Ofloxacina. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Tratamiento de sobredosis:

Debido a que no existe un antídoto específico para la sobredosis de antibióticos Fluoroquinolónicos, el tratamiento debe ser sintomático y de soporte. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para disminuir la absorción:

La inducción del vómito o realizar un lavado gástrico para vaciar el estómago. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 1540-1541.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1228-1229.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 310.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 954-955.



OLANZAPINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Olanzapina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

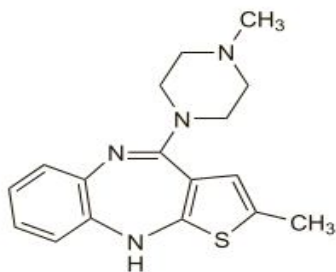
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

2-Metil-4-(4-metil-1-piperazinil)-10H-tieno[2,3-b][1,5]benzodiazepina. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antimaniaco; Agente antipsicótico atípico. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento de las manifestaciones de esquizofrenia; tratamiento de

episodios de manía aguda o mixta relacionados con trastorno bipolar I (como monoterapia o en combinación con Litio o Valproato); terapia de mantenimiento de trastorno bipolar; agitación aguda (pacientes con esquizofrenia o manía bipolar); en combinación con Fluoxetina para depresión bipolar I resistente a tratamiento. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Olanzapina es una tienobenzodiazepina antipsicótica de segunda generación que presenta antagonismo potente de los receptores de serotonina 5-HT_{2A} y 5-HT_{2C}, Dopamina D₁₋₄, Histamina H₁ y alfa₁ adrenérgicos. Olanzapina muestra antagonismo moderado de los receptores 5-HT₃ y muscarínicos M₁₋₅ y unión débil de los receptores de GABA-A, BZD y beta adrenérgicos. Pese a que se desconoce el mecanismo de acción exacto en esquizofrenia y trastorno bipolar, se piensa que la eficacia de la Olanzapina esta mediada por el antagonismo combinado de los sitios receptores de dopamina y serotonina tipo 2. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** se absorbe bien; no se afecta por los alimentos; las tabletas simples y las tabletas de



desintegración oral son bioequivalentes.(Lacy, 2011).

- **Distribución:** V_d : extensa, 1000 L.(Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** plasma: 93% unida a albúmina y glucoproteína alfa₁.(Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** se metaboliza en gran parte mediante glucuronidación directa y citocromo P450 mediante oxidación (CYP1A2, CYP2D6); 40% se elimina mediante metabolismo de primer paso.(Lacy, 2011).
- **Biodisponibilidad:** mayor a 57%.(Lacy, 2011).
- **Vida media:** de eliminación 21 a 54 horas; aproximadamente 1.5 veces mayor en personas de edad avanzada.(Lacy, 2011).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** aproximadamente 6 horas.(Lacy, 2011).
- **Excreción:** en orina (57%, 7% como fármaco sin cambios); en heces (30%). Depuración: incremento de 40% en la depuración de Olanzapina en fumadores; disminución de 30% en mujeres.(Lacy, 2011).

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Esquizofrenia/trastorno bipolar:

Adolescentes:

De 13 años o mayores, oral inicial: 2.5 a 5 mg 1 vez/día; ajustar en 2.5 a 5 mg hasta el objetivo de dosis de 10 mg/día; intervalo de dosificación de 2.5 a 20 mg/día.(Lacy, 2011).

Episodios maniacos o mixtos agudos en trastorno bipolar I:

Adultos:

Monoterapia: inicial: 10 a 15 mg 1 vez/día; incrementar en 5 mg/día con intervalos no menores de 24 horas.

Mantenimiento: 5 a 20 mg/día; dosis máxima recomendada 20 mg/día.

Tratamiento combinado (con Litio o Valproato): inicial: 10 mg 1 vez/día; intervalo de dosificación: 5 a 20 mg/día; dosis máxima recomendada 20 mg/día.(Lacy, 2011).

Depresión relacionada con trastorno bipolar (en combinación con Fluoxetina):

Adultos:

Inicial: 5 mg por la noche; ajustar según la tolerancia a un intervalo usual de 5 a 12.5 mg/día.

Esquizofrenia:

Adultos:

Inicial: de 5 a 10 mg 1 vez/día (incrementar a 10 mg 1 vez/día en menos de 5 a 7 días); después de ajustar en 5 mg/día con intervalos de 1 semana, hasta un máximo recomendado de 20 mg/día.



Mantenimiento: 10 a 20 mg 1 vez/día. Se han utilizado dosis de 30 a 50 mg/día; sin embargo, dosis mayores de 10 mg/día no han demostrado eficacia y no se ha evaluado la seguridad ni la eficacia en niños con dosis mayores de 20 mg/día.(Lacy, 2011).

Depresión resistente a tratamiento (en combinación con Fluoxetina):

Adultos:

Inicial: 5 mg por la noche; ajustar según la tolerancia a un intervalo usual de 5 a 12.5 mg/día.(Lacy, 2011).

Ancianos:

Considerar disminuir la dosis de inicio en 2.5 a 5 mg/día para personas de edad avanzada o pacientes debilitados; puede incrementarse como se indique clínicamente con vigilancia estrecha de la presión arterial ortostática.(Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Precauciones: debido a que provoca sedación moderada a intensa, debe utilizarse con precaución en padecimientos en los cuales la depresión del SNC es una característica; advertir a los pacientes sobre llevar a cabo tareas que requieren un buen estado de alerta (por ejemplo operación de maquinaria o conducción de vehículos). Usar con cautela en pacientes con enfermedad cardiaca. Emplear con cuidado en

enfermedad de parkinson, predisposición a crisis convulsivas o enfermedad renal o hepática graves. Han ocurrido arritmias que ponen en peligro la vida con dosis terapéuticas de algunos neurolépticos. Pueden inducir hipotensión ortostática; tener precaución con antecedente de enfermedad cardiovascular, inestabilidad hemodinámica, infarto miocárdico previo o cardiopatía isquémica. Se han notado aumentos del colesterol y triglicéridos. Usar con cautela en pacientes con perfil de lípidos anormal preexistente. La dismotilidad y aspiración esofágica se han relacionado con el uso de antipsicóticos; utilizar con precaución en pacientes con riesgo de neumonía por aspiración. Puede incrementar las concentraciones de prolactina. Puede ocurrir ganancia ponderal significativa (mayor 7% del peso inicial); vigilar la circunferencia de la cintura y el IMC. Puede ocurrir alteración de la regulación de la temperatura corporal central; utilizar con cuidado con el ejercicio extenuante, la exposición al calor, la deshidratación y los medicamentos concomitantes que poseen efectos anticolinérgicos.(Lacy, 2011).

Puede ocasionar efectos anticolinérgicos; utilizar con precaución en pacientes con motilidad gastrointestinal disminuida, retención urinaria, BPH, xerostomía o glaucoma de ángulo estrecho. En relación con otros neurolépticos, Olanzapina tiene potencia moderada de bloqueo colinérgico. Puede ocasionar síntomas extrapiramidales (EPS),



aunque el riesgo de estas reacciones es menor en relación con otros neurolépticos. El riesgo de distonía (y probablemente otros EPS) puede ser mayor con dosis elevadas, el uso de antipsicóticos convencionales, en hombres y pacientes más jóvenes. Puede relacionarse con síndrome neuroléptico maligno (NMS). Puede ocasionar hiperglucemia extrema que pone en riesgo la vida; utilizar con precaución en pacientes con diabetes. Las concentraciones de Olanzapina pueden ser menores en pacientes que fuman. El uso en adolescentes de 13 años o mayores a esta edad puede ocasionar mayor ganancia ponderal y sedación, así como incrementos mayores de colesterol LDL, colesterol total, triglicéridos, prolactina y concentraciones de transaminasas hepáticas en comparación con adultos. Los pacientes adolescentes deben mantenerse con la dosis mínima necesaria.(Lacy, 2011).

La posibilidad de un intento suicida es inherente a la enfermedad psicótica o al trastorno bipolar; usar con cautela en pacientes de alto riesgo durante el inicio del tratamiento. Las prescripciones deben realizarse para la menor cantidad acompañado de una buena atención al paciente.(Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Nota: En estudios in vitro indican que la Olanzapina tiene poco potencial para inhibir el CYP1A2, CYP2C9, CYP2C19, CYP2D6 o

CYP3A. Por lo tanto, la Olanzapina no se espera que interfiera con el metabolismo de los medicamentos que son metabolizados por estas enzimas.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Los agentes que inducen el CYP1A2 o enzimas glucuroniltransferasa, como Omeprazol, Carbamazepina o la Rifampicina: el aclaramiento de Olanzapina puede aumentar, la terapia con Carbamazepina en dosis de 200 mg dos veces al día aumentó la depuración de Olanzapina en un 50%.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Los agentes que inhiben el CYP1A2, como Fluvoxamina: el aclaramiento de Olanzapina puede disminuir, aunque, debido a que múltiples enzimas están involucradas en el metabolismo de la Olanzapina, el efecto de la inhibición de una enzima puede no ser significativo.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Alcohol u otros medicamentos que producen depresión del sistema nervioso central (SNC): los efectos depresores en el sistema nervioso central pueden ser potenciados así como puede ocurrir hipotensión ortostática.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Anticolinérgicos: los efectos anticolinérgicos de cualquiera de



estos medicamentos pueden aumentar con la administración de Olanzapina, la interrupción de la capacidad del cuerpo para reducir la temperatura interna puede ser una consideración especial.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Agentes antihipertensivos: los efectos hipotensores de estos medicamentos pueden mejorar con la Olanzapina.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Agonistas de la Dopamina o Levodopa: Los efectos de estos medicamentos pueden ser antagonizados por la Olanzapina.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Medicamentos hepatotóxicos: efectos asintomáticos, pero clínicamente existe un incremento significativo en el valor de alaninaaminotransferasa incrementos en alrededor del 2% de los pacientes en los estudios previos a la comercialización de la Olanzapina, se recomienda precaución cuando Olanzapina se usa conjuntamente con medicamentos hepatotóxicos.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Valores de pruebas de laboratorio: valores de alaninaaminotransferasa, los

valores de aspartato transaminasa y los valores de gamma-glutamyltranspeptidasa: en los estudios previos a la comercialización, alrededor del 2% de los pacientes con valores basales de alaninaaminotransferasa menores o igual a 90 unidades internacionales por L (UI/L) tuvieron incrementos de valores de alanina mayores de 200 UI/L durante el tratamiento con Olanzapina, ninguno de estos pacientes experimentaron síntomas de disfunción hepática, y en la mayor parte de los casos el valor de la alanina volvió a la normalidad con el tratamiento continuo con Olanzapina; aumento asintomático de aspartato y gamma-glutamyl también se observaron, alrededor del 1% de los pacientes en los ensayos clínicos de tratamiento con Olanzapina por lo que lo suspendieron debido al incremento de los valores de transaminasas.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Concentraciones séricas de prolactina: sostenidas elevaciones se producen durante el tratamiento con Olanzapina.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Se han notado aumentos del colesterol y triglicéridos.(Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central: somnolencia, vértigo, hipotensión



ortostática, ligeros efectos antimuscarínicos transitorios, produce una baja incidencia de síntomas extrapiramidales como la discinesia tardía, la aparición de síntomas extrapiramidales es más probable a dosis elevadas.(Martindale, 2009).

Gastrointestinales: aumento del apetito, aumento de peso.(Martindale, 2009).

Endocrinas y metabólicas: a veces se produce hiperprolactinemia, pero suele ser asintomática, rara vez se producen anomalías de la homeostasia de la glucosa, se han presentado casos de hiperglucemia grave o exacerbación de una diabetes preexistente, que en ocasiones ha conducido a la cetoacidosis o el coma.(Martindale, 2009).

Dermatológicas: edema.(Martindale, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C**.(Lacy, 2011).
- Lactancia: entra en la leche materna, no se recomienda.(Lacy, 2011).
- Las tabletas pueden administrarse sin importar su relación con los alimentos.(Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación: algunos de los efectos que se pueden presentar en casos de intoxicación en especial se mencionan efectos secundarios potenciales como agitación, acatisia, efectos extrapiramidales, trastorno de la personalidad, dolor de pecho, fiebre, síntomas parecidos a la gripe, cambios de humor o mentales, edema periférico, discinesia tardía, disnea, edema facial, cambios menstruales, erupciones en la piel, e intoxicación hídrica.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento para la intoxicación: la participación de múltiples drogas debe ser considerado. No hay un antídoto específico para una intoxicación con Olanzapina. Para disminuir la absorción: puede hacerse un lavado gástrico, después de la intubación de los pacientes que están inconscientes, y la administración de carbón activado con un laxante se debe considerar. Ha demostrado su eficacia el carbón activado para reducir la absorción de la Olanzapina, y puede ser de utilidad ya que la Olanzapina no alcanza los niveles plasmáticos máximos en aproximadamente 6 horas después de la ingestión.(Drug Information for



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento específico:
hipotensión y el colapso circulatorio se pueden tratar con líquidos intravenosos y/o agentes simpaticomiméticos. Para el bloqueo alfa inducido por Olanzapina, simpaticomiméticos con actividad beta agonistas, como la Adrenalina y la Dopamina, podría empeorar la hipotensión y no debe ser utilizado.

- **vigilancia:** continua monitorización del ECG debe ser empleado para detectar posibles arritmias. Estrecha supervisión médica debe continuar hasta que el paciente se recupere.
- **Cuidados de apoyo:** la vía aérea debe ser establecida y mantenida para asegurar una adecuada oxigenación y ventilación. Los pacientes con sobredosis intencional confirmada o que se sospeche que así sea deben ser referidos para consulta psiquiátrica.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: la Olanzapina no puede ser eliminada por medio de diálisis.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2239-2243.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica.(19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp.Pp. 1230-1234.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1012-1014.



OMEPRAZOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Omeprazol.

FORMA FARMACEUTICA:

Cápsulas.

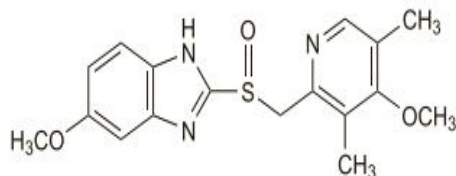
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

(RS)-5-metoxi-2-(4-metoxi-3,5-dimetil-2-piridilmetilsulfinil) bencimidazol, Omeprazol
Magnésico, Omeprazol
Sódico.(Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Bencimidazol sustituido; inhibidor de la bomba de protones.(Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento a corto plazo (4 a 8 semanas) de enfermedad por úlcera duodenal activa o enfermedad por

úlceras gástricas activas benignas; tratamiento de pirosis y otros síntomas relacionados con enfermedad por reflujo gastroesofágico (GERD); tratamiento a corto plazo (4 a 8 semanas) de esofagitis erosiva diagnosticada por endoscopia; mantenimiento de la recuperación de esofagitis erosiva; tratamiento a largo plazo de padecimientos hipersecretorios patológicos; como parte de un esquema multimedicamentoso para erradicación de *H. pylori* fin de disminuir el riesgo de recurrencia de la ulceración duodenal.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: inhibidor de la bomba de protones; suprime la secreción ácida gástrica inicial y estimulada al inhibir la bomba de H⁺/K⁺ ATP de las células parietales.(Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:



- **Inicio de acción:** antsecretor en aproximadamente 1 hora.(Lacy, 2011).
- **Efecto máximo:**en menos de 2 horas.(Lacy, 2011).
- **Duración:**hasta 72 horas; 50% del efecto máximo a las 24 horas después de suspender el tratamiento, la actividad secretora regresa gradualmente en 3 a 5 días.(Lacy, 2011).
- **Absorción:**rápida.(Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:**aproximadamente 95%.(Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático extenso mediante el sistema del citocromo P450 en metabolitos inactivos; efecto de primer paso saturable.(Lacy, 2011).
- **Biodisponibilidad:**oral de aproximadamente 30 a 40%; se incrementa en pacientes asiáticos, ancianos y sujetos con disfunción hepática.(Lacy, 2011).
- **Vida media:** de eliminación de 0.5 a 1 hora; con disfunción hepática aproximadamente 3 horas.(Lacy, 2011).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima :** 0.5 a 3.5 horas.(Lacy, 2011).
- **Excreción:**en orina (aproximadamente 77% como metabolitos, cantidades muy

pequeñas como fármaco sin cambios); en heces.(Lacy, 2011).

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Niños:

De 1 a 16 años

Enfermedad por reflujo gastroesofágico u otros padecimientos relacionados con ácido:

De 5 Kg a <10Kg: 5 mg 1 vez/día.

De 10 Kg a <20 Kg: 10 mg 1 vez/día.

Mayor o igual a 20 Kg: 20 mg 1 vez/día.(Lacy, 2011).

Adultos:

Úlcera duodenal activa:

20 mg/día durante 4 a 8 semanas.(Lacy, 2011).

Úlcera gástrica:

40 mg/día durante 4 a 8 semanas.(Lacy, 2011).

Enfermedad por reflujo gastroesofágico (sin lesiones esofágicas):

20 mg/día hasta por 4 semanas.(Lacy, 2011).

Esofagitis erosiva:

20 mg/día durante 4 a 8 semanas; mantenimiento de la cura: 20 mg/día hasta por 12 meses de tratamiento completo (que incluye el período de tratamiento de 4 a 8 semanas).(Lacy, 2011).



Eradicación de *Helicobacter pylori*: la dosis varía con el esquema:

Etiqueta del fabricante: 40 mg 1 vez/día administrados con Claritromicina 500 mg 3 veces/día durante 14 días o 20 mg 2 veces/día administrados con Amoxicilina 1000 mg y Claritromicina 500 mg 2 veces/día durante 10 días.

Nota: la presencia de una úlcera al momento del comienzo de la terapia puede requerir 14 a 18 días adicionales de Omeprazol 20 mg/día (monoterapia) después de terminado del tratamiento combinado.(Lacy, 2011).

Padecimientos hipersecretores patológicos:

Inicial: 60 mg 1 vez/día; se ha administrado dosis hasta 120 mg 3 veces/día; administrar las dosis diarias, mayor a 80 mg en dosis divididas.(Lacy, 2011).

Pirosis frecuente (OTC):

20 mg/día durante 14 días; el tratamiento puede repetirse después de 4 meses si es necesario.(Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

hipersensibilidad a Omeprazol o a cualquier componente de la formulación.(Lacy, 2011).

Precauciones: el uso de inhibidores de la bomba de protones puede incrementar el riesgo de infecciones gastrointestinales. El

alivio de los síntomas no excluye la presencia de neoplasia maligna gástrica. Se ha observado gastritis atrófica (por biopsia) con el tratamiento a largo plazo con omeprazol.(Lacy, 2011).

Antes de dar inhibidores de la bomba de protones como el Omeprazol los pacientes con úlcera gástrica la posibilidad de malignidad debe ser excluida con anterioridad ya que estos fármacos pueden enmascarar los síntomas y retrasar el diagnóstico. El Omeprazol y otros inhibidores de la bomba de protones debe ser utilizado con precaución en la insuficiencia hepática y el ajuste de la dosis puede ser necesario.(Martindale, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Nota:El Omeprazol, al aumentar el pH gástrico, tiene el potencial para afectar la biodisponibilidad de cualquier medicamento para el cual la absorción es dependiente del pH. Además, el Omeprazol puede impedir la degradación de fármacos ácido-lábiles. Además, debido a la capacidad del Omeprazol para inhibir el metabolismo hepáticomicrosomal de algunas drogas, la eliminación de otros medicamentos que requieren metabolismo hepático a través del sistema del citocromo P450 o que son altamente extraídos por el hígado se puede disminuir durante



el uso concurrente con omeprazol.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

tratamiento con Omeprazol para prevenir el sangrado debido a la potenciación anticoagulante.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Esteres de Ampicilina, sales de hierro o Ketoconazol, Itraconazol:

El Omeprazol puede aumentar el pH gastrointestinal, el uso concomitante con Omeprazol puede resultar en una reducción en la absorción de los ésteres de ampicilina, sales de hierro, el Itraconazol y el Ketoconazol.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Depresores de la médula ósea:

El uso concomitante de Omeprazol con estos medicamentos puede aumentar los efectos leucopénicos y/o trombocitopénicos de estos dos medicamentos, y si el uso es concurrente se requiere una estrecha observación de los efectos tóxicos.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Derivado de los anticoagulantes Cumarina o Indandiona, el Diazepam, la Fenitoína:

la inhibición del sistema enzimático del citocromo P450 por el Omeprazol, especialmente en dosis altas, puede causar una disminución en el metabolismo hepático de estos medicamentos, lo cual puede resultar en retraso en la eliminación y aumento de la concentración en sangre, cuando estos medicamentos se utilizan concomitantemente con Omeprazol. Seguimiento de las concentraciones en sangre, o tiempo de protrombina de los anticoagulantes, se recomienda como una guía para la dosis ya que el ajuste de dosis de estos medicamentos puede ser necesario durante y después del

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Valores de pruebas de laboratorio:

alaninaaminotransferasa, fosfatasa alcalina, aspartatoaminotransferasa: Los valores séricos pueden aumentar.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Gastrina sérica: la concentración aumentará durante la primera o segundasemana de tratamiento con omeprazol y volvera a su estado normal después de que el medicamento se interrumpe; este



aumento se debe probablemente a la inhibición de la secreción de ácido, lo que elimina el efecto de retroalimentación negativa sobre la gastrina en cuanto a la secreción ácida; además de estimular la secreción de ácido gástrico, la gastrina estimula el crecimiento y proliferación de células endocrinas o enterocromafines preferentemente en la mucosa gástrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Los inhibidores de la bomba de protones son bien tolerados, por lo que los efectos adversos son poco frecuentes:

Sistema nervioso central: cefalea, mareo. (Lacy, 2011).

Dermatológicas: exantema. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales: dolor abdominal, diarrea, náusea, vómito, flatulencia, regurgitación ácida, estreñimiento, perversión del gusto. (Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: dolor de espalda, debilidad. (Lacy, 2011).

Respiratorias: infecciones de vías respiratorias superiores, tos. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C.** (Lacy, 2011).
- Lactancia: entra en la leche materna, no se recomienda. (Lacy, 2011).
- Interacción con los alimentos: la combinación de Omeprazol con alimentos retrasan la absorción. (Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Nota: para más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un centro toxicológico. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

síntomas de intoxicación: los siguientes efectos han sido seleccionados sobre la base de su significancia clínica potencial: visión borrosa, confusión, diaforesis (sudoración aumentada), fatiga, sequedad de boca; enrojecimiento, dolor de cabeza, malestar general (sensación general de malestar o enfermedad), náuseas, taquicardia (latido del corazón rápido o irregular). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Tratamiento para la intoxicación:

ya que no existe un antídoto específico para la sobredosis con Omeprazol, el tratamiento debe ser sintomático y de soporte y de apoyo. Debido a la amplia unión a las proteínas, el Omeprazol no es fácilmente dializable. Pacientes en los que se ha confirmado o se sospecha una sobredosis intencional deben ser referidos para consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2244-2247.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp. Pp. 1239-1241.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1753-1756.



OXIMETAZOLINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Oximetazolina.

FORMA FARMACEUTICA:

Solución oftálmica.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

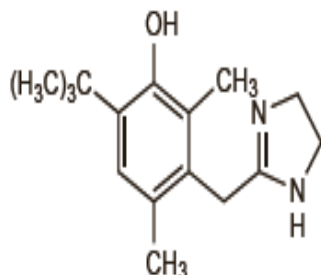
Nombre químico: 3-(4,5-dihidro-1*H*-imidazol-2-ilmetil)- 2,4-dimetil-6-tert-butil-fenol. (Martindale, 2009).

Sinónimos: Clorhidrato de Oximetazolina. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Descongestionante (oftálmica). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Enrojecimiento ocular (tratamiento): La Oximetazolina está indicado para el alivio temporal del enrojecimiento asociado con irritaciones menores del ojo, tales como las causadas por el polen relacionados con alergias, resfriados, polvo, viento, nadar o usar lentes de contacto. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: La Oximetazolina es una amina simpaticomimética de acción directa. Actúa sobre los receptores alfa-adrenérgicos en las arteriolas de la conjuntiva para producir vasoconstricción, lo que resulta en la disminución de la congestión conjuntival. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

FARMACOCINÉTICA:

- **Inicio de acción:** 5 a 10 min. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Duración:** 5 a 6 h. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



DOSIS:

DOSIFICACIÓN USUAL

Oftálmica:

Niños \geq 6 años y adultos: instilar una o dos gotas en el ojo afectado dos a cuatro veces/día (espaciar \geq 6 h). (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Las consideraciones médicas y contraindicaciones incluidas han sido seleccionadas sobre la base de su potencial significancia clínica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Riesgo-beneficio deben ser considerados cuando los siguientes problemas médicos existen:

Enfermedad arterial coronaria o enfermedad cardíaca, incluyendo angina de pecho o Hipertensión:

Si la absorción sistémica significativa de Oximetazolina oftálmica se produce, la condición puede ser exacerbada por los efectos inducidos por las drogas cardiovasculares. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Enfermedad ocular, infección o lesión:

Puede enmascarar los síntomas y el tratamiento demora. (Drug

Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Glaucoma de ángulo estrecho:

Puede precipitar un ataque mediante la dilatación de la pupila. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Hipertiroidismo:

Puede exacerbar la taquicardia existente o presión arterial elevada. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Precauciones:

Sensibilidad cruzada y / o problemas relacionados con:

Los pacientes sensibles a otros simpaticomiméticos oftálmicos pueden ser sensibles a este medicamento también. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Embarazo / Reproducción:

Embarazo: La Oximetazolina puede ser absorbida sistémicamente. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Lactancia materna:

Los problemas en los seres humanos no se han documentado, sin embargo, la Oximetazolina puede ser absorbida sistémicamente. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Usar con cautela en pacientes con hipertiroidismo, cardiopatía, hipertensión, diabetes mellitus,



hipertensión intraocular o hipertrofia prostática. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Las siguientes interacciones con drogas y / o problemas relacionados han sido seleccionados sobre la base de su potencial significancia clínica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Los Antidepresivos Tricíclicos o Maprotilina:

Si la absorción sistémica significativa de Oximetazolina oftálmica se produce, el uso concurrente puede potenciar el efecto presor de la Oximetazolina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Oculares: prurito, midriasis, hipertensión intraocular, visión borrosa. (Taketomo, 2009).

Nota: La dosis excesiva y / o el uso prolongado puede causar mayor irritación de la conjuntiva. El uso prolongado también puede causar hiperemia reactiva. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Aquellos que indican necesidad de atención médica:

Con una dosis excesiva y / o el uso prolongado:

Hiperemia, reactiva (aumento de la irritación o enrojecimiento de los ojos). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **C** (Taketomo, 2009).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2304, 2305.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1567.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 987.



OXITOCINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Oxitocina.

FORMA FARMACEUTICA:

Solución Inyectable.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Nombre químico: Cys-Tyr-Ile-Gln-Asn-Cys-Pro-Leu-Gly-NH₂ cíclico (1 →6)disulfuro;[2-Leucina,7isoleucina] vasopresina. (Martindale, 2009).

Sinónimos: Pit. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente oxitócico. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Inducción de labor de parto a término; control de sangrado posparto; tratamiento adyuvante en manejo de aborto. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Produce las contracciones uterinas rítmicas características del parto. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Inicio de acción:** contracciones uterinas: IM: 3 a 5 min; IV: aproximadamente 1 min. (Lacy, 2011).
- **Duración:**
IM: 2 a 3 h
IV: 1 h.2
- **Metabolismo:** hepático rápido y mediante plasma (por Oxitocinasas) y en menor grado en la glándula mamaria. (Lacy, 2011).
- **Vida media:** eliminación: 1 a 5 min. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** en orina. (Lacy, 2011).



DOSIS:

La administración IV requiere el uso de una bomba de infusión. (Lacy, 2011).

Adultos:

Inducción de labor de parto: IV: 0.5 a 1 miliunidades/min; aumentar de manera gradual la dosis en incrementos de 1 a 2 miliunidades/min hasta que el patrón de contracción deseado se establezca; la dosis puede disminuirse después de alcanzar la frecuencia de contracciones deseada y el parto ha progresado a 5 a 6 miliunidades/min proporcionan concentraciones de Oxitocina similares a las de la labor de parto espontáneo; son necesarias velocidades > 9 a 10 miliunidades/min en raras ocasiones. (Lacy, 2011).

Sangrado posparto:

IM: dosis total de 10 unidades después del parto. (Lacy, 2011).

IV: 10 a 40 unidades por infusión IV en 1000 ml de líquido intravenoso a una velocidad suficiente para controlar la atonía uterina. (Lacy, 2011).

Tratamiento adyuvante de aborto: IV: 10 a 20 miliunidades/min; dosis máxima total: 30 unidades/12 h. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Oxitocina o a cualquier componente de la formulación; desproporción cefalopélvica significativa; posiciones fetales desfavorables; estrés fetal; útero hipertónico o hiperactivo; está contraindicado en parto vaginal (cáncer cervicouterino invasivo, herpes genital activo, prolapso del cordón umbilical, presentación del cordón, placenta previa total o vasa previa. (Lacy, 2011).

Precauciones: Las dosis elevadas o la hipersensibilidad a Oxitocina pueden ocasionar hipertonicidad, espasmo, contracción tetánica o rotura del útero. La intoxicación grave por agua con convulsiones, coma y muerte se relaciona con una infusión lenta de Oxitocina durante 24 h. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Nota: Las combinaciones que contengan cualquiera de los siguientes medicamentos, dependiendo de la cantidad presente, también puede interactuar con este medicamento. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Anestésicos, inhalación de Hidrocarburos, tales como: Ciclopropano, Enflurano, Isoflurano Halotano, (Drug Information for the



Health Care Professional USP DI, 2007).

Anestesia con Ciclopropano puede disminuir la taquicardia, pero empeorar la hipotensión provocada por la Oxitocina, la bradicardia sinusal materna y la alteración de los ritmos auriculoventriculares se han reportado con el uso concomitante, aunque la correlación es controvertido. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Alteraciones de laboratorio: Los siguientes han sido seleccionados sobre la base de su potencial significancia clínica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Valores de las pruebas de laboratorio:

Se ha informado la presencia de bilirrubina, de concentración sérica neonatal, y de ictericia neonatal; aunque no está claro si la ictericia se debe a la Oxitocina o al proceso de trabajo del mismo. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

El efecto antidiurético de la Oxitocina puede causar reducción de las concentraciones séricas maternas y la intoxicación de agua. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

La frecuencia no se ha definido. (Lacy, 2011).

Feto o neonato:

Cardiovasculares: arritmias (que incluyen contracciones ventriculares prematuras), bradicardia. (Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: daño cerebral o del SNC (permanente), crisis convulsivas neonatales. (Lacy, 2011).

Hepáticas: ictericia neonatal. (Lacy, 2011).

Oculares: hemorragia retiniana neonatal. (Lacy, 2011).

Misceláneo: muerte fetal. (Lacy, 2011).

Madre:

Cardiovasculares: arritmias, episodios hipertensivos, contracciones ventriculares prematuras. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales: náusea, vómito. (Lacy, 2011).

Genitourinarias: hematoma pélvico, hemorragia posparto, hipertonicidad uterina, contracción tetánica del útero, rotura uterina, espasmo uterino. (Lacy, 2011).



Hematológicas: afibrinogenemia (fatal). (Lacy, 2011).

Misceláneo: reacción anafiláctica, hemorragia subaracnoidea. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **X** (Lacy, 2011).
- Sólo debe utilizarse para inducción médica de la labor de parto en lugar de inducción electiva. (Lacy, 2011).
- Puede producir efectos antidiuréticos (es decir, intoxicación por agua y contracciones uterinas excesivas. (Lacy, 2011).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2306-2308.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1269, 1270.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 2015.



PACLITAXEL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Paclitaxel.

FORMA FARMACEUTICA:

Solución Inyectable.

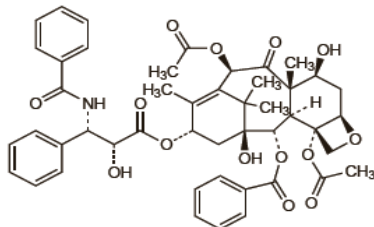
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Nombre químico: (2S, 5R, 7S, 10R, 13S) -10,20-bis(acetoxi)-2-benzoiloxi-1,7-dihidroxi-9-oxo-5,20-epoxytax-11-en-13-ilo(3S)-3-benzoilamino-3-fenil-D-lactato. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antineoplásico antimicrotubular; Agente antineoplásico derivado de fuentes naturales (plantas); Antineoplásico derivado de taxanos. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Tratamiento para el cáncer de mama metastásico avanzado, cáncer de ovario metastásico y sarcoma de Kaposi relacionado con síndrome de inmunodeficiencia adquirida (SIDA) refractario a la terapéutica convencional; activo en cánceres de pulmón, cabeza y cuello, vejiga, melanoma maligno, otros tumores refractarios y leucemias. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Paclitaxel promueve el ensamblado de microtúbulos al reforzar la actividad de los dímeros de tubulina, con lo que estabiliza los microtúbulos existentes e inhibe su desensamblado, lo cual interfiere con la fase mitótica G₂ tardía e inhibe la replicación celular. Además, el fármaco puede distorsionar los husos mitóticos, lo que ocasiona rotura de los cromosomas. También puede suprimir la proliferación celular y modular la respuesta inmune. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Distribución:** bifásica, con distribución inicial rápida al compartimiento periférico; la fase tardía es una salida lenta de



Paclitaxel del comportamiento periférico:

- **Unión a proteínas:** 89 a 98%. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** las isoenzimas hepáticas del citocromo P450 metabolizan el Paclitaxel en 6-alfahidroxipaclitaxel. (Taketomo, 2009).
- **Vida media:** (varia con la dosis y duración de la infusión):
Niños: 4.6 a 17 h.
Adultos: 1.5 a 8.4 h. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** urinaria, con recuperación del fármaco son modificar: 1.3 a 12.6%. (Taketomo, 2009).
- **Diálisis:** no hay eliminación importante del fármaco por hemodiálisis. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Dosificación usual: Infusión IV

Niños:

Aún se investiga para el tratamiento de leucemia refractaria: infusión de 250 a 360 mg/m²/dosis durante 24 h cada 14 días. (Taketomo, 2009).

Tumor de Wilms recurrente: 250 a 350 mg/m²/dosis administrados durante 24 h cada tres semanas. (Taketomo, 2009).

Adultos: IV: referirse a protocolos individuales. (Lacy, 2011).

Carcinoma ovárico: 135 a 175 mg/m² durante 3 h cada 3 semanas o 135 mg/m² durante 24 h cada 3 semanas o 50 a 80 mg/m² durante 1 a 3 h de manera semanal o 1.4 a 4 mg/m²/día como infusión continua durante 14 días cada 4 semanas. (Lacy, 2011).

Cáncer de mama metastásico:

175 a 250 mg/m² durante 3 h cada 3 semanas o 50 a 80 mg/m² cada semana o 1.4 a 4 mg/m²/día como infusión continua durante 14 días cada 4 semanas. (Lacy, 2011).

Carcinoma pulmonar no microcítico:

135 mg/m² durante 24 h cada 3 semanas. (Lacy, 2011).

Sarcoma de Kaposi relacionado con SIDA:

135 mg/m² durante 3 h cada 3 semanas o 100 mg/m² en 3 h cada 2 semanas. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y

PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Paclitaxel, el (aceite de castor polioxielido) o cualquier componente de la formulación. (Lacy, 2011).

Precauciones: El Paclitaxel no se recomienda en pacientes con disfunción hepática grave. Este medicamento se prepara en aceite de ricino Polietoxilado y debe



evitarse en pacientes con hipersensibilidad a esta sustancia. (Lacy, 2011).

El preparado contiene también alcohol y deben tenerse en cuenta los efectos de éste sobre el SNC. El recuento sanguíneo debe monitorearse con frecuencia. En los pacientes que hayan experimentado previamente anomalías importantes en la conducción cardíaca se realiza una monitorización de la función cardíaca continua mientras reciban el Paclitaxel. (Martindale, 2009).

Pediatría:

No hay información disponible sobre la relación entre la edad a los efectos de Paclitaxel en pacientes pediátricos, aunque en fase I de estudios en niños han sido reportados. La seguridad y eficacia no han sido establecidas. (Martindale, 2009).

Geriatría:

Un estudio retrospectivo sobre la relación entre la edad a los efectos de Paclitaxel no encontró diferencias en la intensidad de dosis realizados en pacientes de edad avanzada. (Martindale, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Las siguientes interacciones con drogas y / o problemas relacionados han sido seleccionados sobre la base de su potencial significancia clínica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: Las combinaciones que contengan cualquiera de los siguientes medicamentos, dependiendo de la cantidad presente, también puede interactuar con este medicamento. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Discrasia sanguínea que causan los medicamentos:

Efectos leucopénicos y trombocitopenia puede aumentar con la terapia concurrente o reciente si estos medicamentos causan los mismos efectos, ajustar la dosis de Paclitaxel, si es necesario. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Depresores de la médula ósea:

Radioterapia:

Puede ocurrir depresión de la médula ósea; reducción de la dosis puede ser necesaria cuando dos o más depresores de médula ósea, incluyendo la radiación, se utilizan simultánea o consecutivamente. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La severidad de la neutropenia inducida por Paclitaxel puede estar relacionado con el grado de tratamiento mielotóxico. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Vacunas, virus muertos:

Debido a que los mecanismos de defensa normales pueden estar suprimidos por la terapia con



Paclitaxel, la respuesta del paciente a la vacuna puede estar disminuida. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Evitar el uso concomitante:

Evitar el uso concomitante de Paclitaxel con cualquiera de los siguientes: BCG; Natalizumab; Primecrolimus, Tacrolimus (tópica). (Lacy, 2011).

Aumento del efecto/toxicidad:

Paclitaxel puede incrementar las concentraciones/efectos de: fármaco antineoplásicos (Antraciclina); DOXO-rubicina; Leflunomida; Natalizumab; Trastuzumab; Vacunas vivas; Vinorelbina. (Lacy, 2011).

Disminución del efecto:

Paclitaxel pueden disminuir las concentraciones/efectos de: BCG; Saxagliptina; Vacunas (inactivadas); Vacunas (vivas). (Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Alteraciones de laboratorio:

Los valores de fosfatasa alcalina en suero y Aspartato Aminotransferasa y concentraciones de bilirrubina, se pueden aumentar de forma transitoria. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: hipotensión o hipertensión, infarto del miocardio,

taquicardia, bradicardia. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: convulsiones, ataxia, fatiga, cefalea, fiebre, confusión. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: exantema, alopecia, urticaria, angiedema, síndrome de Stevens-Johnson (raro). (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: hipertriglicerdemia. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea/vómito (7 a 13 %), diarrea, mucositis leve o moderada. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: neutropenia grave (toxicidad limitante de la dosis), leucopenia, trombocitopenia, anemia. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: elevación de Aminotransferasa de Aspartato, incremento de fosfatasa alcalina (> %), bilirrubina. (Taketomo, 2009).

Locales: eritema, hipersensibilidad, inflamación en el sitio de la inyección. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: neuropatía periférica (dependiendo de la dosis), mialgia, debilidad muscular, disfunción motora, artralgias. (Taketomo, 2009).

Oculares: pérdida de la agudeza visual, diplopía. (Taketomo, 2009).

Renales: elevación de creatinina sérica. (Taketomo, 2009).



Respiratorias: disnea. (Taketomo, 2009).

Diversas: reacciones anafilactoides (disnea, broncoespasmo, hipotensión, urticaria generalizada, intoxicación por alcohol. (Taketomo, 2009).

4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 988-990.

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **D** (Taketomo, 2009).
- Advertencia en la caja de EU; se han informado reacciones de hipersensibilidad graves; la premedicación puede minimizar este efecto. Suspender la infusión y no reexponer en busca de reacciones de hipersensibilidad graves. (Lacy, 2011).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2309, 2312.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1271-1272.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 759.



PANTOPRAZOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Pantoprazol.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas recubiertas enteras.
Polvo para uso parenteral.

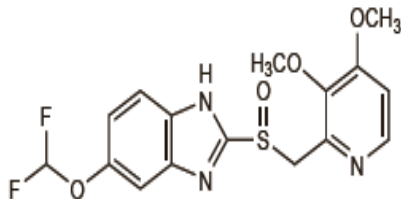
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Nombre químico:
5-Difluoromethoxybenzimidazol-2-il
3,4-dimetoxi-2-piridilmetil sulfóxido.
(Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERA- PÉUTICA:

Agente gastrointestinal para el tratamiento de úlcera gástrica o duodenal; Inhibidor de la bomba de protones; Inhibidor de la secreción de ácido gástrico.⁴

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Oral: tratamiento y mantenimiento de la cicatrización de la esofagitis erosiva vinculada con GERD; disminuye en las tasas de recaídas de los síntomas de pirosis diurna y nocturna en la GERD. (Taketomo, 2009).

Tratamiento de cuadros patológicos con hipersecreción, que incluyen síndrome de Zollinger-Ellison; terapéutica adyuvante de úlceras duodenales por *Helicobacter pylori*. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:
Suprime la secreción gástrica de ácido por inhibición de la bomba de H^+/K^+ ATP en las células parietales. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** rápida y buena. (Lacy, 2011).
- **Distribución: V_d :** 11 a 24 L. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** 98%, principalmente a albúmina. (Lacy, 2011).



- **Metabolismo:** hepático amplio; CYP2C19 (desmetilación), CYP3A4; no hay pruebas de que los metabolitos tenga actividad farmacológica. (Lacy, 2011).
- **Biodisponibilidad:** 77 %.(Lacy, 2011).
- **Vida media, eliminación:** 1 h; se aumenta a 3.5 a 10 h en presencia de deficiencia de CYP2C19. (Lacy, 2011).
- **Tiempo de concentración máxima: oral:** 2.5 h. (Lacy, 2011).
- **Excreción:**
Orina: 71 %
Heces: 18%.(Lacy, 2011).

DOSIS:

ORAL:

Niños \geq 5 años (uso no autorizado): GERD, esofagitis erosiva relacionada con GERD: 20 a 40 mg 1 vez/día. (Lacy, 2011).

ADULTOS:

Esofagitis erosiva relacionada con GERD:

Tratamiento: 40 mg 1 vez/día hasta 8 semanas; se puede usar durante 8 semanas adicionales en pacientes que no han presentado cicatrización después de un ciclo de 8 semanas. Mantenimiento de la cicatrización: 40 mg 1 vez/día. (Lacy, 2011).

Nota: se han usado con éxito dosis menores (20 mg 1 vez/día) en el tratamiento del GERD y el mantenimiento de la cicatrización. (Lacy, 2011).

Trastornos de hipersecreción (incluido el síndrome de Zollinger-Ellison): inicial: 40 mg cada 12 h; ajustar la dosis con base en las necesidades del paciente; se han administrado dosis de hasta 240 mg/día. (Lacy, 2011).

Erradicación de Helicobacter pylori (uso no autorizado): pautas del American College Of Gastroenterology; (Chey, 2007): Sin alergia a la Penicilina: 40 mg 2 veces/día administrados con 1000 mg de Claritromicina y 500 mg de Metronidazol cada 12 h durante 10 a 14 días o 40 mg 1 o 2 veces/día administrados con 525 mg de Subsalicilato de Bismuto y 250 mg de Metrodinazol más 500 mg de Tetraciclina 4 veces/día durante 10 a 14 días. (Lacy, 2011).

IV:

Esofagitis erosiva relacionada con GERD: 40 mg 1 vez/día durante 7 a 10 días. (Lacy, 2011).

Trastornos de hipersecreción: 80 mg cada 12 h; el ajuste de dosis se basa en las medidas de secreción de ácido; se han usado 160 a 240 mg/día en dosis fraccionadas durante un periodo limitado (hasta 7 días). (Lacy, 2011).

Prevención de una nueva hemorragia o de una úlcera péptica (uso no autorizado): 80 mg,



seguidos por administración de 8 mg/h en solución durante 72 h.

Nota: 1 dosis diaria de 40 mg en solución no aumenta lo suficiente el pH gástrico para favorecer la coagulación ante hemorragias GI activas. (Lacy, 2011).

Ancianos: no se requiere ajuste de la dosis. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Pantoprazol, Inhibidores Benzimidazólicos sustituidos de la bomba de protones (es decir, Esomeprazol, Omeprazol, Lansoprazol o cualquier componente de la fórmula. (Taketomo, 2009).

Precauciones: el uso de inhibidores de la bomba de protones puede aumentar el riesgo de infecciones gastrointestinales (p. ej., por especies de salmonella, Campylobacter). (Lacy, 2011).

El tratamiento prolongado (por lo general > 3 años) puede llevar a absorción inadecuada de la vitamina B₁₂ y su deficiencia subsecuente. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Las siguientes interacciones con drogas y / o problemas han sido seleccionados sobre la base de su potencial significancia clínica. (Drug

Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Evitar uso concomitante:

Evitar su uso concomitante a: Delavirdina, Erlotinib, Nelfinavir, Posaconazol. (Taketomo, 2009).

Incremento del efecto y la toxicidad:

Puede aumentar los niveles y efectos de: Metotrexate, Raltegravir, Saquinavir, Topotecán, Voriconazol. (Taketomo, 2009).

Sus niveles y efectos pueden aumentar por: Fluconazol, Ketoconazol. (Taketomo, 2009).

Reducción del efecto:

Puede disminuir los niveles y efectos de: Atazanavir, Clopidogrel, Etxilato de Dabigatrán, Dasatinib, Delavirdina, Erlotinib, Indinavir, sales de Hierro, Itraconazol, Ketoconazol, Mesalamina, Micofenolato, Nelfinavir, Posaconazol. (Taketomo, 2009).

Sus efectos y niveles puede disminuir por: inductores de CYP2C19 (potentes), Peginterferon alfa-2b, Tipranavir. (Taketomo, 2009).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Se han observado resultados falsos positivos de detección de Tetrahidrocanabinol (THC) en la orina de pacientes que reciben inhibidores de la bomba de



protones, incluido el Pantoprazol.
(Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: dolor torácico, taquicardia, angina, palpitaciones hipertensión, hipotensión, síncope, angiedema (edema de Quincke). (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: cefalea, mareo, vértigo, insomnio, ansiedad, fiebre, nerviosismo, confusión, depresión, labilidad emocional, alucinaciones, migraña, trastornos del lenguaje. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: urticaria, prurito, acné, alopecia, sequedad de la piel, exantema maculopapular, trastornos dermatológicos graves raros como síndrome de Stevens-Johnson, eritema multiforme, necrólisis epidérmica tóxica. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: hiperglucemia, hiperlipidemia, bocio, gota. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: diarrea, náusea, dolor abdominal, vómito, constipación, flatulencia, dispepsia, eructos, xerostomía, anorexia, duodenitis, disfagia, glositis, halitosis, heces anormales, cambio de color de la lengua, colitis ulcerosa. Pancreatitis (rara), sialorrea. (Taketomo, 2009).

Genitourinarias: poliaquiuria, infección de vías urinarias, nefritis intersticial (rara). (Taketomo, 2009).

Hematológicas: trombocitopenia, leucopenia, leucocitosis, anemia, pancitopenia (rara), anemia perniciosa. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: hepatitis, elevación de pruebas de función hepática, ictericia colestásica, dolor biliar, hiperbilirrubinemia. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: calambres, mialgias, artralgias, dolor cervical, hipertonía, dorsalgia, parestesias, disminución de reflejos, dolor ósea, bursitis, elevación de CPK, rabdomiólisis (rara). (Taketomo, 2009).

Oculares: ambliopía, diplopía, parálisis extraocular, glaucoma, neuropatía óptica anterior isquémica, visión borrosa. (Taketomo, 2009).

Óticas: otalgia, tinnitus. (Taketomo, 2009).

Renales: hematuria, piuria, proteinuria, glucosuria, nefritis intersticial (rara). (Taketomo, 2009).

Respiratorias: rinitis, bronquitis, tos, disnea, faringitis, sinusitis, infección de las vías respiratorias superiores. (Taketomo, 2009).

Diversas: anafilaxia, síndrome semejante a influenza, infección. (Taketomo, 2009).



ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **B** (Taketomo, 2009).
- Se refiere gastritis atrófica en biopsias obtenidas de pacientes sometidos a tratamiento prolongado con Pantoprazol, en particular aquéllos con positividad previa a *H. Pylori*. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Sobredosis:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un centro toxicológico. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Efectos clínicos de la sobredosis:

No se informaron efectos adversos en caso de sobredosis de un solo agente con Pantoprazol en dosis de 400 y 600 mg. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Síntomas: leve taquicardia, vasodilatación, somnolencia, confusión, dolor de cabeza, visión borrosa, dolor abdominal, náuseas y vómitos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

El tratamiento de la sobredosis:

Lavado gástrico o carbón activado pueden ser utilizado en casos de intoxicación.

Los pacientes en quienes se haya confirmado o se sospecha una sobredosis intencional deben ser referidos para consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2319-2321.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1289, 1290.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 988, 999.

PAROXETINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Paroxetina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas recubiertas simples.

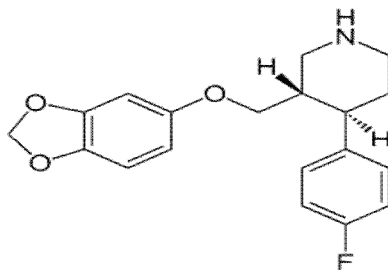
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Sinónimos: Clorhidrato de Paroxetina; Mesilato de Paroxetina. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antidepresivo inhibidor selectivo de la recaptura de serotonina. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Tratamiento de depresión, trastorno obsesivo compulsivo, trastorno de pánico, trastorno de ansiedad social, trastorno de ansiedad generalizado y trastorno de estrés postraumático. (Taketomo, 2009).

Tabletas de liberación controlada, como Clorhidrato: tratamiento de depresión, trastorno de pánico, trastorno de ansiedad social, trastorno disfórico premenstrual. (Taketomo, 2009).

Tabletas, como Mesilato: tratamiento de depresión, trastorno obsesivo compulsivo, trastorno de pánico. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

La Paroxetina es un Inhibidor selectivo de la recaptura de serotonina (ISRS) no relacionado químicamente con Antidepresivos Tricíclicos, Tetracíclicos u otros; la inhibición de la recaptura de serotonina en las sinapsis neuronales del SNC potencia la actividad local de la serotonina. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:



- **Inicio de acción:** efectos antidepresivos: una a cuatro semanas. Efectos contra obsesión y pánico: varias semanas. (Taketomo, 2009).
- **Absorción:** oral: buena. (Taketomo, 2009).
- **Distribución:** Vd (adultos): promedio: 8.7 Ukg; intervalo: 3 a 28 Ukg. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:** 95%. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** extenso por enzimas del citocromo P450 mediante oxidación y metilación, seguida de glucuronidación sulfatación; pueden observarse cinéticas no lineales con dosis más altas y tratamiento más prolongado a causa de saturación de CYP2D6 del P450, una isoenzima parcialmente responsable de su metabolismo; Nota: la farmacocinética de la Paroxetina no se ha estudiado en pacientes con deficiencia de CYP2D6 (es decir, metabolizadores deficientes). (Taketomo, 2009).
- **Biodisponibilidad:** la tableta de liberación inmediata y la suspensión oral tienen la misma biodisponibilidad. (Taketomo, 2009).
- **Vida media:** adultos: promedio: 21 h; Intervalo: 3 a 65 h. (Taketomo, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:**
Tabletas de liberación inmediata:
Clorhidrato: promedio: 5.2 h
Mesilato: promedio: 8.1 h
Tabletas de liberación controlada: 6 a 10 h. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** se excretan metabolitos en orina y bilis; 2% del fármaco se elimina sin modificar en la orina. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Oral: Nota: para terapéutica de mantenimiento, usar la dosis efectiva más baja y revalorar periódicamente la necesidad de continuar el tratamiento. Niños y adolescentes: Nota: no está aprobada por la FD. (Taketomo, 2009).

Depresión: la FDA recomienda no usar Paroxetina en pacientes pediátricos para el tratamiento de la depresión. Tres estudios bien controlados en pacientes pediátricos con depresión no mostraron superioridad terapéutica sobre el placebo; además, se observó un aumento del riesgo de conducta suicida en los pacientes que recibían Paroxetina cuando se comparó con otros ISRS. (Taketomo, 2009).

Trastorno obsesivo compulsivo (TOC): un estudio abierto de 12 semanas de duración en 20 pacientes externos de 8 a 17 años



demonstró su utilidad potencial en los TOC pediátricos; las dosis se iniciaron a razón de 10 mg/día y podían aumentarse cada dos semanas en incrementos no mayores de 10 mg/día, hasta un máximo de 60 mg/día. (Taketomo, 2009).

Conducta autolesiva: un niño autista de 15 años con conducta autoagresiva logró un tratamiento exitoso con 20 mg/día de paroxetina. (Taketomo, 2009).

Adultos:

Depresión:

Tabletas, como clorhidrato y Mesilato: inicial: 20 mg/día una vez al día, de preferencia en la mañana; aumentar si es necesario en incrementos de 10 mg/ día a intervalos de cuando menos una semana; dosis máxima: 50 mg/día. (Taketomo, 2009).

Tabletas de liberación controlada, como Clorhidrato: inicial: 25 mg/día una vez al día de preferencia en la mañana; si es necesario aumentar de 12.5 mg/día a intervalos de cuando menos una semana; dosis máxima: 62.5 mg/día. (Taketomo, 2009).

Trastorno de ansiedad generalizada: tabletas, como Clorhidrato y Mesilato: inicial: 20 mg/día, una vez al día de preferencia en la mañana; dosis recomendada 20 mg/día; intervalo: 20 a 50 mg/día; las dosis > 20 mg tal vez no tengan un beneficio adicional; si la dosis se aumenta, ajustar en incrementos de 10 mg/día

a intervalos de una semana. (Taketomo, 2009).

Trastorno obsesivo compulsivo:

Tabletas, como Clorhidrato y Mesilato: inicial: 20 mg/día administrados una vez al día, de preferencia en la mañana; aumentar 10 mg/día a intervalos de cuando menos una semana; dosis recomendada: 40 mg/ día; intervalo: 20 a 60 mg/día; dosis máxima: 60 mg/día. (Taketomo, 2009).

Trastorno de pánico:

Tabletas, como Clorhidrato y Mesilato: inicial: 10 mg/día administrados una vez al día, de preferencia en la mañana; aumentar de 10 mg/día a intervalos de cuando menos una semana; dosis recomendada: 40 mg/día; intervalos: 10 a 60 mg/día; dosis máxima: 60 mg/día. (Taketomo, 2009).

Tabletas de liberación controlada, como Clorhidrato: inicial: 12.5 mg/día administrados una vez al día, de preferencia en la mañana; aumentar, si se requiere, 12.5 mg/día a intervalos de cuando menos una semana; dosis máxima: 75 mg/día. (Taketomo, 2009).

Trastorno de estrés

postraumático: Tabletetas, como clorhidrato: inicial: 20 mg/día administrados una vez al día de preferencia en la mañana; dosis recomendada: 20 mg/día; intervalo: 20 a 50 mg/día; las dosis de 40 mg/día no han mostrado beneficio adicional respecto a 20 mg/día; si está indicado, aumentar la dosis 10 mg/día en intervalos de por lo



menos una semana. (Taketomo, 2009).

Trastorno disfórico premenstrual:

Tabletas de liberación controlada, como Clorhidrato: inicial: 12.5 mg/día administrados una vez al día, de preferencia en la mañana; si es necesario, aumentar a 25 mg/día después de por lo menos una semana; puede administrarse a diario durante el ciclo menstrual o limitarlo a la fase lútea. (Taketomo, 2009).

Trastorno de ansiedad social:

Tabletas, como Clorhidrato: inicial: 20 mg/día administrados una vez al día, de preferencia en la mañana; dosis recomendada: 20 mg/día; intervalo: 20 a 60 mg/día; las dosis mayores de 20 mg no han mostrado beneficio adicional. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Paroxetina o cualquier componente de la fórmula; uso de inhibidores de la monoaminoxidasa en los 14 días previos (pueden ocurrir reacciones potencialmente letales; véase Interacciones medicamentosas); uso concurrente de Tioridazina. (Lacy, 2011).

Precauciones: Usar con cautela en pacientes con antecedente de convulsiones, manía, enfermedad renal, enfermedad cardíaca o enfermedad hepática, y en

individuos suicidas, niños o durante la lactancia materna; modificar la dosis en pacientes con disfunción renal o hepática. Puede causar hiponatremia; usar con precaución en personas con depleción de volumen o uso de diuréticos. Es posible que ocasione hemorragia anormal (p. ej., equimosis, púrpura, hemorragia gastrointestinal alta); emplear con cuidado en individuos con alteración de la agregación plaquetaria y con administración concurrente de Ácido Acetilsalicílico, antiinflamatorios no esteroideos y otros medicamentos que afectan la coagulación. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Con inhibidores de la MAO pueden ocurrir fiebre, temblores, convulsiones, hipertensión, delirio, coma (el uso de inhibidores de la MAO en el transcurso de 14 días de la administración de Paroxetina está contraindicado). El Triptofano (que puede metaboizarse a Serotonina) y la hierba de San Juan (*Hypehcum perforatum*) pueden aumentar los efectos secundarios graves de la Serotonina (Síndrome Serotoninérgico); el uso de estos agentes no se recomienda. (Lacy, 2011).

El uso combinado de ISRS y Anfetamina, Buspirona, Dextrometorfán, Meperidina, Nefazodona, agonistas de Serotonina, Sibutramina, otros ISRS, Simpatomiméticos, Ritonavir, Linezolid, Litio, Tramadol y Venlafaxina pueden aumentar el



riesgo de síndrome serotoninérgico.
(Taketomo, 2009).

Incremento de efecto y toxicidad con Alcohol, Cimetidina, Fenotiacinas, Antiarrítmicos tipo 1c. Aumento de los efectos y toxicidad de Antidepresivos Tricíclicos, Risperidona, Atomoxetina (se recomienda una dosis inicial más baja de Atomoxetina; tal vez se requiera un ajuste de dosis posterior), Fluoxetina, Sertralina, Teofilina, Warfarina, Antiinflamatorios no Esteroideos, Ácido Acetilsalicílico, otros fármacos que afectan la coagulación (incremento del riesgo de hemorragia), Tioridazina (la Paroxetina puede inhibir el metabolismo de Tioridazina y aumentar el riesgo de efectos cardíacos graves, como prolongación del intervalo QTc, arritmias ventriculares, taquicardias ventriculares helicoidales y muerte súbita. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: palpitaciones, taquicardia, vasodilatación, hipotensión ortostática, bradicardia, hipotensión. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: cefalea, somnolencia, mareo, insomnio, nerviosismo, agitación, ansiedad, migraña, dificultad para concentrarse, bostezo, labilidad emocional, hostilidad, hipercinesia, acatisia (inquietud psicomotora), alucinaciones; ideación y conducta suicidas. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: alopecia, púrpura, equimosis, fotosensibilidad. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: hiponatremia (en pacientes con depleción de volumen), secreción inadecuada de hormona antidiurética, disfunción sexual. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, xerostomía, constipación, vómito, diarrea, anorexia, flatulencia, gastritis, dolor abdominal. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: anemia, leucopenia. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: debilidad, temblor, artritis, parestesias, astenia. (Taketomo, 2009).

Oculares: dolor ocular, visión borrosa. (Taketomo, 2009).

Óticas: otalgia. (Taketomo, 2009).

Respiratorias: asma, rinitis. (Taketomo, 2009).

Diversas: diaforesis, sed, bruxismo, acinesia; síntomas de abstinencia después de su suspensión abrupta. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **D** (Taketomo, 2009).



- Interacción con alimentos: Los complementos de Triptofano pueden aumentar sus efectos secundarios importantes; su empleo no se recomienda. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Efectos clínicos de sobredosis:

Los siguientes efectos se han seleccionado sobre la base de su potencial clínico:

Pupilas dilatadas, mareos, somnolencia, sequedad de boca, enrojecimiento de la cara, irritabilidad, náuseas, taquicardia sinusal, temor, vómitos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento de la sobredosis:

No existe un antídoto específico para la Paroxetina. El tratamiento es esencialmente sintomático y de apoyo. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para disminuir la absorción:

Es recomendable lavado gástrico, seguido de la administración de 20 a 30 gramos de carbón activado cada 4 a 6 horas durante las primeras 24 a 48 horas después de la ingestión. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2323, 2324.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1295, 1296.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1005-1006.

PEMETREXED

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Pemetrexed.

FORMA FARMACEUTICA:

Liofilizado para uso parenteral.

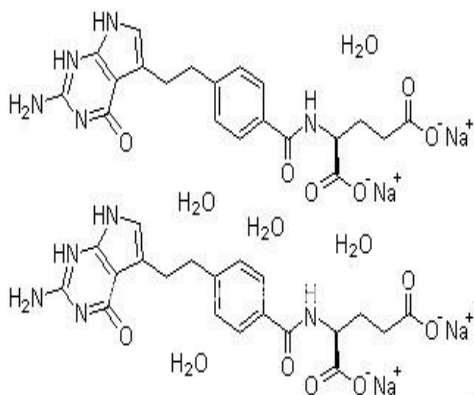
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Sinónimos: LY231514; Pemetrexed disódico. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antineoplásico antimetabolito; Agente antineoplásico (antifolato). (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Tratamiento del mesotelioma pleural maligno irresecable (en combinación con Cisplatino); terapéutica del cáncer pulmonar no microcítico, no escamoso, localmente avanzado o metastásico (NSCLC; como inicial o en combinación con Cisplatino como esquema terapéutico de mantenimiento con un solo agente después de 4 ciclos del doble a base de Platino y el único después de quimioterapia). (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Antifolato; modifica los procesos metabólicos dependientes del Folato. Inhibe a la sintetasa de Timidilato (TS), la reductasa de Dihidrofolato (DHFR), la Formiltransferasa de Glicinamida Ribonucleótico (GARFT), y la Formiltransferasa de Aminoimidazol Carboxamida Ribonucleótido (AICARFT), enzimas que participan en el metabolismo del Folato y la síntesis de DNA, con el resultado de una inhibición de la síntesis de nucleótidos de Purinas y Timida, y la de proteínas. (Lacy, 2011).



FARMACOCINÉTICA:

- **Duración:** V_{dss} : 16.1 L. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** aproximadamente 73 a 81%. (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** mínimo. (Lacy, 2011).
- **Vida media, eliminación:** con función renal normal: 3.5 h; Cl_{cr} 40 a 59 ml/min; 5.3 a 5.8 h. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** en orina (70 a 90% como fármaco sin cambios). (Lacy, 2011).

DOSIS:

Nota: iniciar los complementos de vitaminas 1 semana antes de la primera dosis de Pemetrexed: deben tomarse 350 a 1000 mg/día de Ácido Fólico por vía oral (tomar al menos 5 de cada 7 días antes del inicio del tratamiento; continuar durante el tratamiento y por 21 días después de la última dosis de Pemetrexed) y 1000 mg de vitamina B₁₂ IM durante la semana previa al inicio del tratamiento y a continuación cada 3 ciclos. Administrar 4 mg de Dexametasona por vía oral 2 veces/día durante 3 días, a partir del día previo al tratamiento para disminuir las reacciones cutáneas. (Lacy, 2011).

IV: adultos:

Mesotelioma pleural maligno: 500 mg/m² en el día 1 de cada ciclo de 21 días (en combinación con Cisplatino) o (no autorizado) en combinación con Carboplatino. (Lacy, 2011).

Cáncer pulmonar no microcítico:

Tratamiento inicial: 500 mg/m² en el día 1 de cada ciclo de 21 días (en combinación con Cisplatino). (Lacy, 2011).

Tratamiento de mantenimiento o de segunda línea: 500 mg/m² en el día 1 de cada ciclo de 21 días como agente único. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad grave al Pemetrexed o a cualquier componente de la formulación. (Lacy, 2011).

Precauciones: Agente peligroso, puede causar supresión de la médula ósea (anemia, neutropenia, trombocitopenia o pancitopenia); puede requerir disminución de la dosis en ciclos subsecuentes. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante. No hay interacciones conocidas por las



que se recomienda evitar el uso concomitante. (Lacy, 2011).

Las concentraciones/efectos de Pemetrexed pueden aumentar por: (AINE) (no selectivos). (Lacy, 2011).

No hay interacciones significativas conocidas que impliquen un decremento del efecto. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

10%:

Sistema nervioso central (25 a 34%; limitante de la dosis). (Lacy, 2011).

Dermatológicas:

exantema/descamación (10 a 14%).²(Lacy, 2011).

Gastrointestinales: náusea (19 a 31%), anorexia (19 a 22%), vómito (9 a 16), estomatitis, diarrea. (Lacy, 2011).

Hematológicas: anemia, leucopenia, neutropenia. (Lacy, 2011).

Respiratorias: faringitis. (Lacy, 2011).

1 a 10%:

Cardiovasculares: edema. (Lacy, 2011).

SNC: fiebre. (Lacy, 2011).

Dermatológicas: prurito, alopecia, eritema multiforme. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales; estreñimiento, disminución de peso, dolor abdominal. (Lacy, 2011).

Hematológicas: trombocitopenia, neutropenia febril. (Lacy, 2011).

Hepáticas: aumento de ALT, aumento de AST. (Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: neuropatía sensorial, neuropatía motora. (Lacy, 2011).

Oculares: conjuntivitis, aumento del lagrimeo. (Lacy, 2011).

Renales: aumento de la creatinina sérica, disminución de la depuración de creatinina. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **D** (Lacy, 2011).

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1313-1315.



PENCICLOVIR

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Penciclovir.

FORMA FARMACEUTICA:

Crema Tópica.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

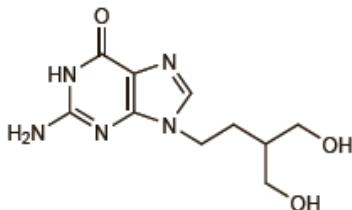
Nombre químico: 9 - [4-hidroxi-3-(hidroximetil)butil] guanina. (Martindale, 2009).

Sinónimos: PCV. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antiviral tópico. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Tratamiento tópico del herpes simple labial (fuegos). (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

En células infectadas con VHS-1 o VHS-2, la cinasa de Timidina viral fosforila el Penciclovir en un monofosfato que las cinasas celulares convierten en Trifosfato de Penciclovir. El Trifosfato de Penciclovir inhibe a la polimerasa de VHS por competencia con el Trifosfato de Desoxiguanosina, con lo cual impide la síntesis y replicación del ADN viral. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** tópica: insignificante. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

- **Niños \geq 12 años y adultos:**

Tópica: aplicar crema al primer signo o síntoma de herpes labial (p.ej., hormigueo, edema); aplicar



cada 2 h mientras esté despierto durante 4 días. (Lacy, 2011).

Administración: Tópica: aplicar sólo a herpes en labios y cara. Aplicar suficiente cantidad para cubrir las lesiones y friccionar suavemente el área afectada. Evitar la aplicación en los ojos o cerca de ellos, porque puede causar irritación. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad al Penciclovir o cualquier componente de la fórmula, reacciones previas o importantes al famciclovir. (Taketomo, 2009).

Precauciones:

Pediatría:

No hay información disponible sobre la relación entre la edad a los efectos de Penciclovir en pacientes pediátricos. La seguridad y eficacia no han sido establecidas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Lactancia materna:

No se sabe si el Penciclovir se distribuye a la leche materna después de la aplicación tópica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

No se dispone de datos de la seguridad y eficacia de la aplicación de Penciclovir en las membranas mucosas. Su eficacia en pacientes

inmunocomprometidos o niños < 18 años aún no se establece. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar uso concomitante: No se conocen interacciones con esta implicación. (Taketomo, 2009).

Incremento del efecto y la toxicidad: No se conocen interacciones significativas. (Taketomo, 2009).

Reducción del efecto: No se conocen interacciones significativas. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Aquellos que indican necesidad de atención médica:

Incidencia rara:
Solicitud de reacción en el lugar. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Aquellos que indica la necesidad de atención médica sólo si continúan o son molestos:

La incidencia más frecuente:
Dolor de cabeza: incidencia del 5,3%.

Incidencia menos frecuente:
Hipoestesia (disminución anormal



de sensibilidad, sobre todo al toque), erupción cutánea, eritema (enrojecimiento de la piel); cambio del sentido del gusto. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Locales: anestesia local, reacción en el sitio de aplicación. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **B** (Taketomo, 2009).
- Lactancia: Se desconoce si se excreta en la leche materna. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un Centro de Control de Envenenamientos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento:

No hay información acerca de la sobredosis. El Penciclovir se absorbe bien tras la administración oral. Las reacciones adversas relacionadas con la ingestión de Penciclovir son poco probables. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2334.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1315.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1567.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1011, 1012.



PIRAZINAMIDA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Pirazinamida.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Pirazino-2-carboxamida.
(Martindale, 2009).

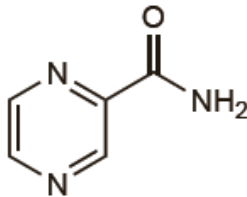
Sinónimos:

Amida del Ácido Pirazinoico.
(Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antifímico. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

En combinación con otros fármacos Antifímicos, para el tratamiento de infección tuberculosa por *Mycobacterium* (sobre todo en tuberculosis diseminada y meníngea); los CDC (Centers for Disease Control) recomiendan un régimen de múltiples fármacos, tres o cuatro, que incluye Pirazinamida, Rifampicina, Isoniazida y en ocasiones Etambutol o Estreptomina, para el tratamiento de tuberculosis. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Se convierte en Ácido Pirazinoico en cepas susceptibles de mycobacterium tuberculosis, lo que disminuye el pH del ambiente; no se ha dilucidado el mecanismo exacto de su acción. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción: oral:** se absorbe bien. (Taketomo, 2009).
- **Distribución:** se distribuye con amplitud en tejidos y líquidos corporales, inclusive hígado, pulmón y líquido cefalorraquídeo. (Taketomo, 2009).



- **Unión a proteínas:** 50%. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** hepático. (Taketomo, 2009).
- **Vida media:** 9 a 10 h, prolongada con función renal o hepática reducida. (Taketomo, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** 2 h. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** en orina (4% como fármaco sin modificar). (Taketomo, 2009).

DOSIS:

ORAL:

Lactantes, niños y adolescentes: 20 a 40 mg/kg/día divididos en dosis cada 12 a 24 h durante los dos primeros meses de tratamiento activo; la dosis diaria no debe exceder 2 g; o Pirazinamida diaria durante dos semanas, seguida de terapéutica bajo observación directa con 50 mg/kg/dosis dos veces a la semana hasta un máximo de 2 g/dosis por seis semanas. (Taketomo, 2009).

Adultos: 15 a 30 mg/kg/día divididos en una a cuatro dosis los dos primeros meses del tratamiento activo; dosis diaria máxima: 3 g/día; o Pirazinamida a diario por dos semanas, seguida de terapéutica bajo observación directa con 50 a 70 mg/kg/dosis dos veces a la

semana hasta un máximo de 4 g/dosis por seis semanas. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Pirazinamida o cualquier componente de la formulación, gota aguda, daño hepático grave. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

La Isoniazida (disminuye los niveles séricos); la terapéutica combinada con Rifampicina se relaciona con reacciones hepatotóxicas graves y letales. (Taketomo, 2009).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Los siguientes valores fueron seleccionados en base a su y potencial y mayor significancia clínica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Con diagnostico de exámenes de laboratorio:

Determinación de cetonas en la orina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Valores de prueba fisiológicos/laboratorio:

Se pueden incrementar los valores de Alanina Aminotransferasa (ALT [SGPT]) y Aspartato Aminotransferasa (AST [SGOT]).



(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La concentración de Acido Úrico en el suero se puede incrementar. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central: malestar, fiebre. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: urticaria, exantema, fotosensibilidad. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: gota, hiperuricemia. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, vómito, anorexia, dolor abdominal. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: hepatotoxicidad (aumento de la incidencia con dosis > 30 mg/kg/día), ictericia. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: artralgias. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Usar con precaución en pacientes con antecedentes de alcoholismo, insuficiencia renal, gota crónica, diabetes mellitus o porfiria. (Lacy, 2011).

La hepatotoxicidad relacionada con la dosis va desde aumentos

transitorios de ALT/AST hasta hepatitis o atrofia hepática (rara). (Lacy, 2011).

Usar con precaución en pacientes que reciben medicamentos concomitantes vinculados con hepatotoxicidad (en partículas la Rifampicina). (Lacy, 2011).

REFERENCIAS:

- (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2520-2522.
- Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1038-1039.
- Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 320.
- Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1346-1347.



PIROXICAM

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Piroxicam.

FORMA FARMACEUTICA:

Capsulas.
Tabletas dispensables.

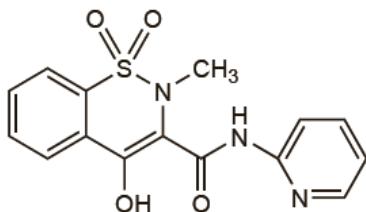
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

(8E)-8-[hidroxi-(piridin-2-ilamino) metilidene]-9-metil-10,10-dioxo-10λ6-tia-9-azabicyclo[4.4.0] deca-1,3,5-trien-7-ona.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente Antiinflamatorio; Analgésico Narcótico; Fármaco Analgésico Antiinflamatorio no esteroideo (AINE), oral. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento de enfermedades inflamatorias y trastornos reumatoides; dismenorrea. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Inhibe la síntesis de prostaglandinas por disminución de la actividad de la enzima (ciclooxigenasa), lo que da como resultado disminución de la formación de precursores. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Distribución:** se distribuye en la leche materna a una concentración aproximada de 1 a 3% de aquella del plasma materno. (Taketomo, 2009).
- **Vd:** adultos: 0.14 Ukg. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:** 99%. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** en el hígado. (Taketomo, 2009).
- **Vida media:** adultos: 50 h. (Taketomo, 2009).



- **Eliminación:** se excreta como metabolitos y fármaco sin cambios (5 a 10%) en la orina; una pequeña cantidad se excreta en las heces. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

ORAL:

Niños:

0.2 a 0.3 mg/kg/día una vez al día; dosis máxima: 15 mg/día. (Taketomo, 2009).

Adultos:

10 a 20 mg/kg/día una vez al día; aunque se acompañan de incremento de los efectos gastrointestinales adversos, se han utilizado dosis > 20 mg/día (es decir, 30 a 40 mg/día). (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Piroxicam, cualquier componente de la fórmula, Ácido Acetilsalicílico y otros fármacos antiinflamatorios no esteroideos (AINE); hemorragia gastrointestinal activa, enfermedad ulcerosa; pacientes con la "tríada del Ácido Acetilsalicílico" [asma, rinitis (con o sin pólipos nasales) e intolerancia al Ácido Acetilsalicílico] (estos pacientes pueden presentar

reacciones asmáticas mortales y anafilactoides). (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Sustrato de las isoenzimas CYP2C9 y CYP2C18 del citocromo P450. (Taketomo, 2009).

Puede aumentar los niveles de Litio; el Ácido Acetilsalicílico puede disminuir los niveles séricos de Piroxicam; es posible que los irritantes gastrointestinales (p. ej. complementos de Potasio) incrementen sus efectos gastrointestinales adversos; el Piroxicam puede disminuir los efectos antihipertensivos de inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina o antagonistas de angiotensina II; también pueden ocurrir interacciones medicamentosas similares a las de otros (AINE); el uso concurrente de Piroxicam con Ritonavir no se recomienda. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: edema. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: mareo, cefalea. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: exantema, erupciones fototóxicas cutáneas, fotosensibilidad. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, molestias epigástricas, anorexia,



malestar abdominal, vómito, hemorragia gastrointestinal, úlceras, perforación. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: disminución de hemoglobina y hematocrito, inhibición de la agregación plaquetaria. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: elevación de enzimas hepáticas, hepatitis. (Taketomo, 2009).

Renales: insuficiencia renal aguda, elevación de nitrógeno ureico en sangre, elevación de creatinina sérica. (Taketomo, 2009).

Diversas: reacciones anafilactoides. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Los (AINE) se relacionan con incremento del riesgo de eventos adversos tromboticos cardiovasculares que incluyen infarto miocárdico (IM) y accidente cerebrovascular cerebral con potencial mortal; el riesgo puede aumentarse con la duración de su uso o factores de riesgo o enfermedad cardiovasculares preexistentes; evaluar con cuidado perfil de riesgo cardiovascular antes de prescribir, administrar las dosis efectiva más baja por el tiempo más corto posible con base en las metas de tratamiento del paciente debe considerarse terapia alternativas en pacientes de alto riesgo. Su uso esta contraindicado para el tratamiento de dolor preoperatorio relacionado a CPC. (Taketomo, 2009).

Se observa aumento de incidencia de IM y accidente vascular cerebral en pacientes que reciben (AINE) selectivos para COX-2 para tratamiento de dolor durante los primeros 10 a 14 días posteriores a CPC. Los (AINE) pueden causar retención de líquidos, edema e hipertensión o agravamiento de esta, utilizar con cautela en pacientes con hipertensión, insuficiencia cardiaca congestiva o retención de líquidos. La administración concurrente de Ibuprofeno y otros (AINE) no selectivos podría interferir con el efecto cardioprotector del Ácido Acetilsalicílico. (Taketomo, 2009).

Usar los (AINE) con extrema cautela en individuos con antecedentes de hemorragias o úlceras gastrointestinales (estos pacientes tienen un riesgo 10 veces mayor que de experimentar hemorragia gastrointestinal). Usar con cautela los (AINE) en personas con otros factores de riesgo de hemorragia gastrointestinal (p. ej. Tratamiento concurrente con Acido Acetilsalicílico, Anticoagulantes, Corticoesteroides o todos los anteriores, uso prolongado de (AINE), tabaquismo, consumo de alcohol y mal estado genera). (Taketomo, 2009).

Utilizar la dosis efectiva más baja por el periodo más corto posible con base en los objetivos de tratamiento del paciente, debe considerarse terapias alternativas en pacientes con riesgo algo. (Taketomo, 2009).



Los (AINE) podrían comprometer la función renal existente. Su toxicidad renal puede ocurrir en pacientes con función renal deteriorada, deshidratación, insuficiencia cardiaca, disfunción hepática, que toman diuréticos e inhibidores de la ECA; emplear con cautela en estos individuos, vigilar de manera estrecha la función renal. Los (AINE) no se recomiendan para pacientes con nefropatía avanzada. El uso prolongado de (AINE) puede causar necrosis papilar y lesión renal. (Taketomo, 2009).

Pacientes con la “triada de Ácido Acetilsalicílico” que reciben (AINE) pueden presentar reacciones anafilactoides y asmáticas mortales. (Taketomo, 2009).

Los (AINE) pueden causar reacciones adversas dermatológicas graves que incluyen dermatitis exfoliativa, síndrome de Stevens-Johnson y necrólisis epidérmica toxica. (Taketomo, 2009).

Pueden presentarse una reacción similar a la enfermedad del suero en casos aislados: detectar la aparición de artralgias, prurito, fiebre, fatiga, y exantema. (Taketomo, 2009).

Evitar el uso de (AINE) en el último trimestre de embarazo, porque pueden producir cierre prematuro del conducto arterioso. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Los siguientes efectos han sido seleccionados en base a su potencial significancia clínica posible signos:

Color azulado de las uñas, los labios o la piel, convulsiones, especialmente en niños, dificultad en la audición de sonido o zumbido en los oídos mareos o aturdimiento, alucinaciones, dolor de cabeza severo y permanente, aumento o disminución de la presión arterial náuseas, estado de ánimo o de metal, vómitos o dolor estomacal, edema severo, hinchazón alrededor de los ojos, dificultad para respirar o respiración inusualmente lenta, rápida o irregular, hinchazón de la cara, manos, pies o piernas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento de sobredosis Para disminuir la absorción:

Vaciar el estómago a través de la inducción de la emesis (sólo en pacientes conscientes) o lavado gástrico. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Sin embargo, el jarabe de Ipecacuana puede inducir síntomas similares a los de la toxicidad del Piroxicam, lo que puede complicar el diagnóstico, y no se recomienda para la inducción de la emesis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Administración de carbón vegetal activado.



La eficacia de Carbón Activado en la disminución de la absorción de estos medicamentos cuando se administran más de 2 horas después de la ingestión de la sobredosis no ha sido determinada. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Sin embargo, hay alguna evidencia de que la administración repetida de Carbón Activado, puede entrar en la circulación hepática y/o vincular algunos de los medicamentos que se ha difundido desde la circulación hacia el intestino, lo que aumenta la excreción no renal. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para mejorar la eliminación, la administración de Antiácidos u otros Alcalinizadores urinario puede aumentar excreción de Diflunisal o Sulindac. Los Antiácidos pueden aliviar los efectos adversos gastrointestinales. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La hemodiálisis puede ser necesaria para tratar la insuficiencia renal, pero no puede ser utilizada para disminuir las concentraciones plasmáticas de los (AINE) esto debido a su alto grado de unión a proteínas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

El tratamiento específico en hipotensión severa:

Usar expansores de volumen. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para convulsiones:
El Diazepam u otros Anticonvulsivantes o Benzodiazepinas apropiadas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para Hipoprotrombinemia:

El uso de Vitamina K. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Instituir un tratamiento de apoyo sintomático y otros según sea necesario. Ciertos efectos adversos de los (AINE), incluido el síndrome de nefritis o nefrítico, trombocitopenia, anemia hemolítica, y severas reacciones cutáneas de hipersensibilidad o de otro tipo, pueden responder a la administración de glucocorticoides. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Monitorización:

Debe considerarse que hay posibilidad de ulceración gastrointestinal o hemorragia, y discrasias sanguíneas, pueden aparecer varios días después de la ingestión de una sobredosis. Los pacientes pueden ser dados de alta después del tratamiento inicial, y deben ser informados de los posibles síntomas, y buscar tratamiento inmediato si se presentan. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 438.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 117
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1043-1044.

PROVASTATINA SODICA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Provastatina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

1,1-Dioxido de 4-hidroxi-2-metil-N-2-piridil-2H-1,2-benzotiazina-3-carboxamida. (Martindale, 2009).

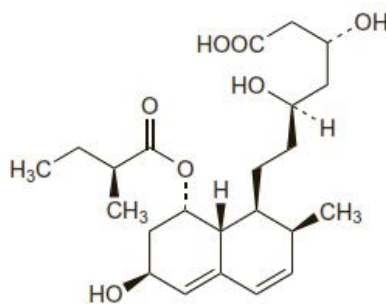
Sinónimos:

Provastatina Sódica. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente Hipolipemiante; Inhibidor de la Reductasa de HMG-CoA. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Hiperlipidemia: Adyuvante del tratamiento dietético para disminuir los niveles elevados de colesterol total y colesterol en lipoproteínas de baja densidad (C-LDL), apolipoproteína B (apo-B) y triglicéridos, y para incrementar el colesterol en lipoproteínas de alta densidad (C-HDL) en pacientes con hipercolesterolemia primaria (heterocigótica, familiar y no familiar) y con dislipidemia mixta (Fredrickson tipos IIa y IIb); terapéutica de hiperlipidemia familiar homocigótica, tratamiento de hipertrigliceridemia aislada (Fredrickson tipo IV) e hiperlipoproteinemia tipo III; tratamiento de disbetalipoproteinemia primaria (Fredrickson tipo III). (Taketomo, 2009).

Prevención primaria de enfermedad cardiovascular en pacientes de alto riesgo; los factores de riesgo incluyen: edad > 55 años, tabaquismo, hipertensión, C-HDL bajo o antecedente familiar de cardiopatía coronaria prematura. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de Acción: La Provastatina es un inhibidor competitivo de la reductasa de 3-hidroxi-3metilglutaril coenzima A



(HMG-CoA), que es la enzima limitante de la velocidad de la reacción que participa en la síntesis nueva de colesterol. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** oral: se absorbe rápido. (Taketomo, 2009).
- **Distribución:** Vd: adultos: 0.46 L/kg. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:** 43 a 55%. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** extenso de primer paso, en metabolitos con actividad mínima. (Taketomo, 2009).
- **Biodisponibilidad:** absoluta: 17%. (Taketomo, 2009).
- **Vida media:** Niños: 1.6 h (intervalo: 0.85 a 4.2 h). (Taketomo, 2009).
- **Adultos:** 2.6 a 3.2 h. (Taketomo, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** 1 a 1.5 h. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** Aproximadamente 20% se excreta en la orina sin cambios y 70% en las heces. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

ORAL:

La dosis debe individualizarse de acuerdo con el nivel basal de C-LDL, el objetivo recomendado del tratamiento y la respuesta del paciente; deben hacerse ajustes a intervalos de cuatro semanas. (Taketomo, 2009).

Hiperlipidemia:

Niños de 8 a 13 años: 20 mg una vez al día; dosis > 20 mg aún no se estudian. (Taketomo, 2009).

Adolescentes de 14 a 18 años: 40 mg una vez al día; dosis > 40 mg aún no se estudian. (Taketomo, 2009).

Adolescentes > 18 años y adultos: 40 mg diarios; la dosis puede aumentarse hasta 80 mg una vez al día si está indicado. (Taketomo, 2009).

Ajuste de dosis en disfunción renal: adultos: iniciar la dosis con 10 mg una vez al día. (Taketomo, 2009).

Ajuste de dosis en disfunción hepática: adultos: iniciar la dosis con 10 mg una vez al día; evitar el uso en enfermedad hepática activa. (Taketomo, 2009).

Ajuste de dosis en pacientes que reciben Ciclosporina concomitante: 20 mg una vez al día. (Taketomo, 2009).



CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Hipersensibilidad a la Provastatina o a cualquier componente de la formulación; hepatopatía activa; elevaciones persistentes no explicadas de las transaminasas séricas; embarazo y lactancia materna. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Las siguientes drogas interactúan y pueden provocar problemas con alto potencial clínico al combinarse con Provastatina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Anticoagulantes Cumarínicos, Colestiramina o Colestipol, Antifúngicos Azoles, Ciclosporina, Gemfibrozil o Inmunosupresores, Antibióticos Macrólidos, Niacina, Antiácidos, Jugo de Uva, Anticonceptivos Orales, Digoxina, Ranitidina, Rifampicina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Valores de prueba fisiológicos/laboratorio:

Concentraciones de creatinina quinasa (CK). Con leves aumentos transitorios son comunes y pueden no estar relacionados con los medicamentos marcados, la miositis y la posible insuficiencia renal, ocurren en aproximadamente

el 0,5% a 1% de los pacientes, aunque la incidencia puede ser mayor en los pacientes de trasplante de órganos tratados con inmunosupresores o Gemfibrozilo. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Transaminasa en el suero:

Los valores puede ser aumentados, por lo general a menos de 3 veces el límite superior de lo normal, en poco menos de 1 a 2% de los pacientes que reciben inhibidores de la HMG-CoA reductasa durante al menos 1 año. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: angina, dolor torácico. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: mareo, cefalea, somnolencia, fatiga, alteraciones del sueño, depresión, ansiedad, nerviosismo, fiebre, vértigo. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: exantema, prurito, urticaria, sequedad de piel, alopecia, dermatitis. (Taketomo, 2009).

Raras: fotosensibilidad, necrólisis epidérmica tóxica, eritema multiforme, inclusive síndrome de Stevens-Johnson. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: ginecomastia, cambios de la libido. (Taketomo, 2009).



Gastrointestinales: constipación, pirosis, flatulencia, dolor abdominal, diarrea, náusea, pancreatitis, gastroenteritis, vómito, hiporexia, disgeusia. (Taketomo, 2009).

Genitourinarias: poliaquiuria, cistitis, nicturia. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: anemia hemolítica (rara). (Taketomo, 2009).

Hepáticas: elevación de transaminasas, hepatitis, ictericia colestásica; raras: cirrosis, necrosis hepática fulminante, hepatoma. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: elevación de CPK, mialgias, calambres, miopatía, parálisis de nervios periféricos, rabdomiólisis, artralgias, debilidad muscular, dermatomiositis. (Taketomo, 2009).

Oculares: visión borrosa, diplopía. (Taketomo, 2009).

Respiratorias: rinitis, tos, disnea, infección de vías respiratorias inferiores. (Taketomo, 2009).

Diversas: reacciones de hipersensibilidad, influenza, síndrome semejante a lupus Eritematoso. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Deben descartarse causas secundarias de hiperlipidemia antes del tratamiento. Se deben vigilar las pruebas de función hepática por laboratorio en forma periódica. Ha

ocurrido rabdomiolisis con insuficiencia renal aguda. El riesgo talvez aumente con el uso concomitante de otros fármacos que pueden causar rabdomiólisis (incluidas Colchicina, Gemfibrozilo, derivados del Ácido Fíbrico, o Niacina a dosis ≥ 1 g/día). (Lacy, 2011).

Descontinuar de forma temporal en cualquier paciente que experimente un trastorno agudo o grave que predisponga la insuficiencia renal secundaria a rabdomiólisis. Con base en pruebas actuales, el tratamiento con inhibidores de la reductasa de HMG-CoA debe continuar en el periodo preoperatorio, a menos que los riesgos superen al beneficio cardioprotector.

Usar con precaución en pacientes ancianos, pues están predispuestos a las miopatías. (Lacy, 2011).

Utilizar con precaución en pacientes con hepatopatía previa o uso intenso de etanol. No se recomienda en el tratamiento de pacientes < 8 años de edad. (Lacy, 2011).

REFERENCIAS:

- (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 1673-1674.
- Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica.



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



- (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1380-1379
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1374
 4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1052-1053

PRIMAQUINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Primaquina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

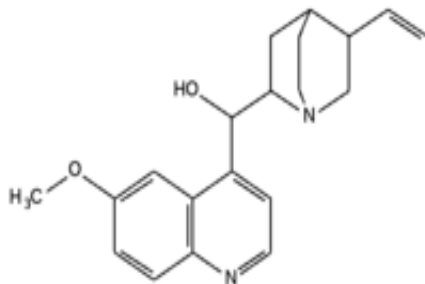
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Fosfato de Primaquina; Primacona. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antipalúdico. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Aunado a un fármaco esquizonticida sanguíneo, para la curación radical de paludismo por *P. vivax* o *P. ovale* después de confirmar un ataque clínico mediante frotis sanguíneo o título serológico; prevención de recaída de paludismo por *P. ovale* o *P. vivax*, profilaxia posterior a exposición a paludismo. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Elimina las formas exoeritrocíticas hísticas primarias de *P. falciparum*, *P. mairiae*, *P. ovale* y *P. vivax*, interfiere con el ADN del plasmodio. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Metabolismo:** hepático en Carboxiprimaquina, un metabolito activo. (Taketomo, 2009).
- **Vida media:** 3.7 a 9.6 h. (Taketomo, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** 6 h. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** una cantidad pequeña de fármacos sin



modificar se secreta en la orina.
(Taketomo, 2009).

Adultos: 30 mg 1 vez/día durante 21 días (en combinación con Clindamicina). (Lacy, 2011).

DOSIS:

Dosificación usual

Niños: 0.3 mg/kg/día una vez al día por 14 días sin exceder 15 mg/día o 0.9 mg/kg una vez a la semana por ocho semanas, sin exceder 45 mg/semana. (Lacy, 2011).

Adultos: 15 mg/día una vez al día por 14 días, o 45 mg una vez a la semana por ocho semanas. (Lacy, 2011).

Prevención del paludismo resistente a la Cloroquina (uso no autorizado; pautas de los CDC): iniciar 1 a 2 días antes de viajar y continuar durante 7 días después de la partida de una zona endémica de paludismo:

Niños: 0.5 mg/kg 1 vez/día. (Lacy, 2011).

Adultos: 30 mg 1 vez/día. (Lacy, 2011).

Prevención de la neumonía por *Pneumocystis jiroveci* (uso no autorizado): recomendación de los CDC (como alternativa):

Niños: 0.3 mg/kg 1 vez/día durante 21 días (en combinación con Clindamicina). (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: Pacientes graves con tendencia a presentar granulocitopenia (artritis reumatoide, lupus eritematoso sistémico); individuos que reciben otros fármacos capaces de deprimir la médula ósea; pacientes que reciben Quinacrina. (Taketomo, 2009).

Precauciones: Usar con cautela en pacientes con deficiencia de G6PD o de reductasa de metahemoglobina de NADH. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Quinacrina (aumenta la toxicidad de Primaquina). (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: arritmias, hipertensión. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: cefalea. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: prurito. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, vómito, cólico. (Taketomo, 2009).



Hematológicas: anemia hemolítica, metahemoglobinemia, leucocitosis, leucopenia, agranulocitosis. (Taketomo, 2009).

Oculares: interferencia con la acomodación visual. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **C** (Taketomo, 2009).

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1390-1391.
2. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1011, 1060.

PROBENECID

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Probenecid.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

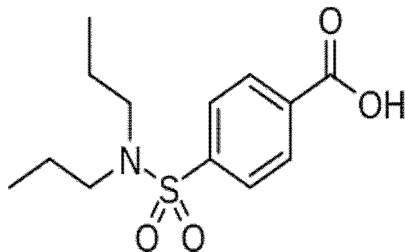
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Benemid [DSC] (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente para tratamiento de la gota;
Agente para disminuir las concentraciones de ácido úrico;
Agente uricosúrico; Terapia adyuvante para incrementar las concentraciones de penicilina. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Prevención de hiperuricemia relacionada con gota y artritis gotosa; tratamiento adyuvante con Penicilinas o Cefalosporinas para prolongar su permanencia en suero. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:
Inhibe de manera competitiva la resorción de Ácido Úrico en el túbulo contorneado proximal; en consecuencia, promueve su excreción y disminuye las concentraciones séricas de Ácido Úrico; aumenta los niveles en plasma de ácidos orgánicos débiles (Penicilinas, Cefalosporinas u otros Antibióticos Betalactámicos) al inhibir de manera competitiva su secreción tubular renal. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** rápida y completa en tubo digestivo. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** 85 a 95% (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático. (Lacy, 2011).



- **Vida media:** 6 a 12 h. (Lacy, 2011).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** 2 a 4 h. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** en orina. (Lacy, 2011).

DOSIS:

Oral:

Niños de 2 a 14 años: inicial: 25 mg/kg/dosis o 0.7 g/m²/dosis en dosis única. (Lacy, 2011).

Mantenimiento: 40 mg/kg/día o 1.2 g/m²/día divididos en cuatro dosis (dosis única máxima: 500 mg). (Lacy, 2011).

Adultos: 500 mg cuatro veces/día. (Lacy, 2011).

Hiperuricemia: adultos: inicial: 250 mg dos veces al día por una semana; aumentar a 500 mg dos veces al día; puede ajustarse en incrementos de 500 mg cada cuatro semanas si se requiere, hasta un máximo de 2 a 3 g/día; iniciar el tratamiento dos o tres semanas después de un ataque agudo de gota. (Lacy, 2011).

Gonorrea: niños > 45 kg y adultos: lineamientos de los CDC (régimen alternativo): 1 g antes del antibiótico elegido (p. ej., Cefoxitina). (Lacy, 2011).

Enfermedad pélvica inflamatoria: Lineamientos de los CDC (régimen alternativo): 1 g antes del antibiótico elegido (p. ej., Cefoxitina). (Lacy, 2011).

Neurosífilis: lineamientos de los CDC (régimen alternativo): 500 mg cuatro veces/día más Penicilina Procáinica 2 400 000 U/día IM, por 10 a 14 días. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad al Probenecid o cualquier componente de la fórmula; niños < 2 años, discrasias sanguíneas, cálculos renales de ácido úrico. (Lacy, 2011).

Precauciones: Usar con cautela en pacientes con úlcera péptica; hematuria, cólico renal; es posible prevenir la formación de cálculos de ácido úrico relacionados con Probenecid mediante la ingesta de líquidos abundantes y la alcalinización de la orina; podría no ser eficaz cuando la D₅₀ es < 30 mL/mln. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Los Salicilatos y el Probenecid inhiben sus acciones uricosúricas entre sí (véase Advertencias); el Probenecid puede incrementar los niveles en plasma (disminuir la excreción) de Aciclovir, Penicilinas, Ciprofloxacina, Ganciclovir, Cefalosporinas, Metotrexate,



Dapsona, fármacos antiinflamatorios no esteroideos (AINE), Antibióticos Carbapenem (p. ej., Ertapenem, Imipenem, Meropenem) y Dapsona; puede disminuir el metabolismo de Zidovudina, Benzodiazepinas y Tiopental. (Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Glucosuria falsa positiva con Clinistest, se ha observado una determinación falsamente alta de Teofilina y se puede inhibir la excreción renal de Fenolsulfonftaleína, 17-cetoesteroides y Bromosulfoftaleína (BSP). (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: rubor. (Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: mareo, cefalea, fiebre. (Lacy, 2011).

Dermatológicas: exantema, alopecia, dermatitis, prurito. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales: anorexia, náusea, vómito, dolor de encías. (Lacy, 2011).

Genitourinarias: poliaquiuria, hematuria. (Lacy, 2011).

Hematológicas: anemia, leucopenia, anemia aplásica, anemia hemolítica (quizá

relacionada con deficiencia de G6PD). (Lacy, 2011).

Hepáticas: necrosis hepática. (Lacy, 2011).

Neuromuscular y esquelética: dolor costovertebral, artritis gotosa (aguda). (Lacy, 2011).

Renales: síndrome nefrótico, cólico renal, cálculos de ácido úrico. (Lacy, 2011).

Diversas: reacciones de hipersensibilidad. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **B**. (Taketomo, 2009).
- Los salicilatos pueden disminuir el efecto terapéutico de Probenecid; Este efecto puede ser más pronunciado con dosis altas y administración crónica; sin embargo, el fabricante recomienda el uso de analgésicos alternativos aun cuando se empleen dosis bajas de Ácido Acetilsalicílico; el tratamiento con Probenecid no debe iniciarse hasta que el ataque agudo de gota ceda; si durante el tratamiento con Probenecid se presenta un ataque de gota agudo, el medicamento puede continuarse pero deben usarse otros agentes adecuados (p. ej., Colchicina)



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



para controlarlo. (Taketomo,
2009).

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1390-1393.
2. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1061, 1062.

PROGESTERONA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Progesterona.

FORMA FARMACEUTICA:

Solución inyectable.

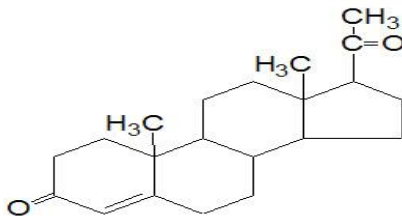
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Pregnenodiona; Progestágeno.
(Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPEÚTICA:

Progestágeno. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

IM: amenorrea; hemorragia uterina anormal por desequilibrio hormonal.

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Hormona esteroide natural que induce cambios secretores en el endometrio, promueve el desarrollo de la glándula mamaria, relaja el músculo liso uterino, obstaculiza la maduración de los folículos y la ovulación, y mantiene el embarazo. Cuando se usa como parte de un programa de ART en la fase lútea, la Progesterona promueve la implantación del embrión. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** gel vaginal: prolongada. (Lacy, 2011).
- **Vida media, absorción:** 25 a 50 h. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** Albúmina (50 a 54%) y proteína de unión del Cortisol (43 a 48%).(Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático hasta metabolitos. (Lacy, 2011).
- **Vida media, eliminación:** gel vaginal: 5 a 20 min. (Lacy, 2011).



- **Tiempo de concentración máxima:** oral: 3 h; IM; 8 h. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** en orina, bilis, heces. (Lacy, 2011).

DOSIS:

Adultos:

IM: mujeres:

-**Amenorrea:** 5 a 10 mg/día durante 6 a 8 días consecutivos. (Lacy, 2011).

-**Hemorragia** uterina funcional: 5 a 10 mg/día por 6 dosis. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Progesterona o cualquier componente de la formulación; hemorragia vaginal anormal no diagnosticada; antecedente de tromboflebitis o trastornos tromboembólicos venosos; antecedente de enfermedad tromboembólica arterial activa o reciente (en el último año) (p. ej. Evento vascular cerebral, MI). (Lacy, 2011).

Precauciones: Emplear con precaución en presencia de enfermedad o disfunción cardiovascular. Los gestágenos usados en combinación con estrógenos pueden aumentar los riesgos de hipertensión, infarto del

miocardio (MI), evento vascular cerebral, embolia pulmonar (PE) y trombosis venosa profunda. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante de Progesterona con cualquiera de los siguientes: Etxilato de Dabigatrán, Silodosina, Topotecan. (Lacy, 2011).

La Progesterona puede aumentar las concentraciones/efectos de: Colchicina; Etxilato de Dabigatrán; sustratos de la P-glucoproteína; Rivaroxaban; Silodosina; Topotecan. (Lacy, 2011).

Las concentraciones/efectos de la Progesterona pueden disminuir por: Aminoglutetimida; inductores de CYP2C19 (fuertes); Deferasirox; Peginterferón alfa-2b. (Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Función tiroidea, metirapona, función hepática, pruebas de coagulación, pruebas de función endocrina. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Inyección (IM):

Cardiovasculares: edema cerebral, trombosis cerebral, edema. (Lacy, 2011).



Sistema nervioso central:

depresión, fiebre, insomnio, somnolencia. (Lacy, 2011).

Dermatológicas: acné, exantema alérgico (raro), alopecia, hirsutismo, prurito, exantema, urticaria. (Lacy, 2011).

Endocrinas y metabólicas: amenorrea, hemorragia por privación, hipersensibilidad mamaria, galactorrea, cambios del flujo menstrual, goteo sanguíneo transvaginal. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales: náusea, aumento/disminución de peso. (Lacy, 2011).

Genitourinarias: cambios de erosión del cuello uterino, cambios de la secreción cervicouterina. (Lacy, 2011).

Locales: en el sitio de inyección: irritación, dolor, eritema. (Lacy, 2011).

Oculares: neuritis óptica, trombosis de la retina. (Lacy, 2011).

Respiratorias: embolia pulmonar. (Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Función tiroidea, metirapona, función hepática, pruebas de coagulación, pruebas de función endocrina. (Lacy, 2011).

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1400-1403.

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **B**. (Lacy, 2011).

PROPOFOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Propofol.

FORMA FARMACEUTICA:

Emulsión inyectable.

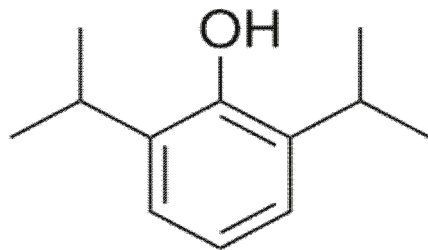
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

2,6-diisopropylfenol. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Anestésico general. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Inducción de anestesia en niños > 3 años y adultos; mantenimiento de la anestesia en niños > 2 meses y adultos: inicio y mantenimiento de sedación para anestesia en adultos; sedación continua de pacientes adultos en la unidad de cuidados intensivos. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:
El Propofol es un compuesto fenólico con propiedades anestésicas generales intravenosas. El fármaco no se relaciona con ninguno de los Anestésicos Intravenosos Barbitúricos, Opioides, Benzodiacepínicos, Arilciclohexilamínicos o Agentes Imidazólicos. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Inicio de la anestesia:** 30 segundos después de su administración en bolo. (Lacy, 2011).
- **Duración:** ~ 3 a 10 min según dosis, velocidad y duración de la administración; con el uso prolongado (p. ej., 10 días de sedación en la UCI), el Propofol se acumula en los tejidos y se



redistribuye hacia el plasma cuando el fármaco se suspende, por lo que el tiempo para despertar (duración de acción) aumenta; sin embargo, si la dosis se ajusta a diario de modo que se utilice la mínima eficaz, el tiempo hasta el despertar puede ser de 10 a 15 min, aun después de su empleo prolongado. (Lacy, 2011).

- **Distribución:** gran volumen de distribución, muy lipofílico. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** 97 a 99%. (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático, por glucuronidación y sulfatación. (Lacy, 2011).
- **Vida media (modelo de tres compartimientos):**
Alfa: 2 a 8 min
Beta (segunda distribución): aproximadamente 40 min.
Terminal: aproximadamente 200 min; intervalo: 300 a 700 min.
Terminal (después de infusión de 10 días): 1 a 3 días. (Lacy, 2011).
- **Eliminación:** aproximadamente 90% se excreta en la orina en forma de metabolitos y < 1% como fármaco sin modificar. (Lacy, 2011).

DOSIS:

La dosis debe individualizarse con base en el peso corporal total y ajustarse hasta el efecto clínico

deseado; guardar por lo menos 3 a 5 min entre los ajustes posológicos a fin de valorar clínicamente los efectos del medicamento; se requieren dosis más pequeñas cuando se utiliza con narcóticos; los siguientes son lineamientos generales de dosificación:

Anestesia general: Inducción IV:

Niños > 3 años, ASA I o II: 2.5 a 3.5 mg/kg; usar una dosis más baja en niños ASA III o IV. (Lacy, 2011).

Adultos, ASA I o II, < 55 años: 2 a 2.5 mg/kg (alrededor de 40 mg cada 10 seg, hasta el inicio de la Inducción). (Lacy, 2011).

Edad avanzada, debilitados, hipovolémicos, o ASA III o IV: 1 a 1.5 mg/kg (alrededor de 20 mg cada 10 seg, hasta el inicio de la inducción). (Lacy, 2011).

Anestesia cardiaca: 0.5 a 1.5 mg/kg (alrededor de 20 mg cada 10 seg, hasta el inicio de la Inducción). (Lacy, 2011).

Pacientes neuroquirúrgicos: 1 a 2 mg/kg (alrededor de 20 mg cada 10 seg, hasta el inicio de la Inducción). (Lacy, 2011).

Mantenimiento: Infusión IV:

Lactantes > 2 meses a niños de 16 años, ASA I o II: Inicial: 200 a 300 ng/kg/min; disminuir la dosis después de 30 min si los signos clínicos de anestesia ligera no son detectables; velocidad usual de Infusión: 125 a 150 ng/kg/min; es



posible que los pacientes pediátricos más pequeños requieran velocidades mayores en comparación con niños de más edad. (Lacy, 2011).

Adultos, (ASA) I o II, < 55 años:
Inicial: 150 a 200 ng/kg/min por 10 a 15 min; disminuir 30 a 50% durante los primeros 30 min del mantenimiento; velocidad usual de infusión: 100 a 200 ng/kg/min. (Lacy, 2011).

Pacientes de edad avanzada, debilitados, hipovolémicos, ASA III o IV: 50 a 100 ng/kg/min. (Lacy, 2011).

Anestesia cardiaca:

Propofol en dosis baja con opioide primario: 50 a 100 ng/kg/min (véase etiqueta del fabricante). Propofol primario con opioide secundario: 100 a 150 ng/kg/min. (Lacy, 2011).

Pacientes neuroquirúrgicos: 100 a 200 ng/kg/mln. (Lacy, 2011).

Sedación para anestesia:

Inicio:

Adultos, (ASA) I o II, < 55 años:

Infusión IV lenta: 100 a 150 ng/kg/mln por 3 a 5 min; inyección lenta: 0.5 mg/kg por 3 a 5 min. (Lacy, 2011).

Pacientes de edad avanzada, debilitados, neuroquirúrgicos o (ASA) III o IV: usar dosis similares a las de adultos sanos; evitar bolos IV rápidos. (Lacy, 2011).

Mantenimiento:

Adultos, (ASA) I o II, < 55 años:

infusión IV a velocidad variable (preferible sobre bolos Intermitentes): 25 a 75 ng/kg/mln; dosis de incremento en bolo: 10 o 20 mg. (Lacy, 2011).

Pacientes de edad avanzada, debilitados, neuroquirúrgicos o (ASA) III o IV: usar 80% de la dosis para adultos sanos; **no administrar** dosis en bolo rápido (único o múltiple). (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad al Propofol o cualquier componente de la fórmula; pacientes sin intubación o ventilación mecánica; se aplican otras contraindicaciones para anestesia general o sedación. (Lacy, 2011).

Precauciones:

Usar con cautela en pacientes con convulsiones o antecedente de epilepsia o enfermedad cardiaca o respiratoria grave; la inyección IV puede producir dolor local transitorio; pueden ocurrir mioclonías perioperatorias; disminuir la dosis y la velocidad de infusión en pacientes de edad avanzada, debilitados o con (ASA) III/IV. Su supresión súbita en enfermos pediátricos puede causar agitación, irritabilidad, temblor, y rubor de manos y pies. Asimismo se observan bradicardia, nerviosismo y agitación. (Lacy, 2011).



INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

La Teofilina puede antagonizar los efectos del Propofol; este último puede aumentar los niveles séricos de Alfentanil; es posible que su toxicidad se incremente con Acetazolamida (inestabilidad cardiorrespiratoria), depresores del sistema nervioso central, Atracurio (anafilaxia), Fenotiacinas, Fentanil (incremento del nivel de Propofol), Guanabenz, Inhibidores de la monoaminoxidasa, analgésicos narcóticos, Vecuronio (incremento del bloqueo neuromuscular); el uso concurrente de Propofol con Fentanil puede causar bradicardia importante en pacientes pediátricos. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: hipotensión (relacionada con la dosis), bradicardia, depresión miocárdica, rubor. (Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: fiebre, cefalea, mareo. (Lacy, 2011).

Dermatológicas: exantema, prurito. (Lacy, 2011).

Endocrinas y metabólicas: hiperlipidemia; se informa acidosis metabólica letal. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales: náusea, vómito, cólico. (Lacy, 2011).

Genitourinarias: coloración de la orina (verde). (Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: mialgias, contracciones, movimiento clónico, mioclonías. (Lacy, 2011).

Respiratorias: acidosis y depresión respiratoria, apnea. (Lacy, 2011).

Diversas: anafilaxia, reacciones anafíctoides. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **B** (Lacy, 2011).

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1410-1413.



PROPRANOLOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Propranolol.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

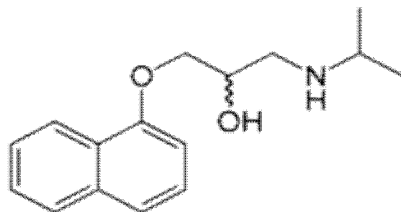
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Clorhidrato de Propranolol. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antianginoso; Agente antiarrítmico, Clase II; Agente antihipertensivo; Agente antimigrañoso; Bloqueador adrenérgico beta. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Tratamiento de hipertensión, angina de pecho, feocromocitoma, temblor esencial, crisis clonónicas de tetralogía de Fallot y arritmias (como fibrilación y aleteo auriculares, taquicardias nodales AV de reentrada y arritmias inducidas por catecolaminas); prevención de infarto miocárdico, cefalea migrañosa; tratamiento sintomático de estenosis subaórtica hipertrófica; terapéutica adyuvante de tloxicosis a corto plazo. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:
Es un bloqueador adrenérgico beta no selectivo (antiarrítmico clase II); bloquea de manera competitiva la respuesta a la estimulación adrenérgica beta¹ y beta², lo que da como resultado disminución de frecuencia cardiaca, contractilidad miocárdica, presión arterial y demanda de oxígeno del miocardio. Los efectos bloqueadores adrenérgicos beta se deben al enantiómero S (-). El Propranolol ejerce también una acción de membrana similar a la Quinidina o anestesia en dosis más altas de las necesarias para el bloqueo beta; esto afecta el potencial de acción



cardíaco (su repercusión clínica es incierta). (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Bloqueo beta:** oral: (liberación inmediata):
Inicio de acción: 1 a 2 h
Duración: ~ 6 h. (Lacy, 2011).
- **Absorción:** oral: rápida y completa. (Lacy, 2011).
- **Distribución:** Vd: adultos: 3.9 L/kg; atraviesa la placenta; pequeñas cantidades aparecen en la leche materna. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas;** en recién nacidos: 68%; en adultos aproximadamente 90% (el isómero S principalmente a la glucoproteína alfa¹ ácida; el isómero R sobre todo a la albúmina. (Lacy, 2011).
- **Biodisponibilidad:** aproximadamente 25% alcanza la circulación sistémica por un metabolismo elevado de primer paso, los alimentos ricos en proteínas aumentan su biodisponibilidad por aproximadamente 50%. (Lacy, 2011).
- **Vida media, distribución:** IV: 5 a 10 min. (Lacy, 2011).

- **Vida media, eliminación** (prolongada con disfunción hepática):
Recién nacidos y lactantes:
posible aumento de la vida media:

Niños: 3.9 a 6.4 h.

Adultos: 4 a 6 h. (Lacy, 2011).

- **Eliminación:** los metabolitos se excretan sobre todo en la orina (96 a 99%); < 1% se excreta en la orina como fármaco sin cambios. (Lacy, 2011).
- **Depuración:** disminuida en disfunción hepática e insuficiencia renal crónica. (Lacy, 2011).
- **Diálisis:** no dializable: (0 a 5%). (Lacy, 2011).

DOSIS:

Dosificación usual

Recién nacidos:

Oral: inicial: 0.25 mg/kg/dosis cada 6 a 8 h; aumentar lentamente si es necesario, hasta un máximo de 5 mg/kg/día. (Lacy, 2011).

IV: inicial: 0.01 mg/kg en bolo lento en 10 min; puede repetirse cada 6 a 8 h por razón necesaria; aumentar poco a poco hasta un máximo de 0.15 mg/kg/dosis cada 6 a 8 h. (Lacy, 2011).

Arritmias:

Oral:



Niños: inicial: 0.5 a 1 mg/kg/día divididos en dosis cada 6 a 8 h; ajustar la dosis en forma ascendente cada tres a cinco días; dosis usual: 2 a 4 mg/kg/día; pueden requerirse dosis mayores; no exceder 16 mg/kg/día o 60 mg/día. (Lacy, 2011).

Adultos: inicial: 10 a 20 mg/dosis cada 6 a 8 h; aumentar de manera gradual; intervalo usual: 40 a 320 mg/día. (Lacy, 2011).

IV:

Niños: 0.01 a 0.1 mg/kg, lento en 10 min; dosis máxima: 1 mg (lactantes); 3 mg (niños). (Lacy, 2011).

Adultos: 1 mg/dosis, lento; repetir cada 5 min hasta un total de 5 mg. (Lacy, 2011).

Hipertensión: oral:

Niños: inicial: 0.5 a 1 mg/kg/día divididos en dosis cada 6 a 12 h; aumentar gradualmente cada cinco a siete días; dosis usual: 1 a 5 mg/kg/día; dosis máxima: 8 mg/kg/día. (Lacy, 2011).

Adultos: inicial: 40 mg dos veces al día, o 60 a 80 mg una vez al día en cápsulas de liberación sostenida o prolongada; aumentar la dosis cada tres a siete días; dosis usual: productos de liberación inmediata: < 320 mg divididos en dos o tres dosis/día; productos de liberación sostenida o prolongada: 120 a 160 mg una vez al día; dosis máxima diaria: 640 mg; intervalo de dosis usual (JNC 7): productos de liberación inmediata: 20 a 80 mg

dos veces al día; productos de liberación sostenida o prolongada: 60 a 180 mg una vez al día. (Lacy, 2011).

Tirotoxicosis:

Recién nacidos: oral: 2 mg/kg/día divididos en dosis cada 6 a 12 h; en ocasiones se requieren dosis mayores. (Lacy, 2011).

Adolescentes y adultos: oral: 10 a 40 mg/dosis cada 6 h. (Lacy, 2011).

Adultos: IV: 1 a 3 mg IV lenta en dosis única. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad al Propranolol o cualquier componente de la fórmula; Insuficiencia cardiaca congestiva (ICC) descompensada, choque cardiogénico, bradicardia o bloqueo cardiaco, asma, enfermedad de vías respiratorias hiperactivas, enfermedad pulmonar obstructiva crónica, síndrome de Raynaud. (Lacy, 2011).

Precauciones: El Propranolol puede bloquear la taquicardia y los cambios de la presión arterial inducidas por hipoglucemia; usar con cautela en personas con diabetes mellitus; se informan aumentos agudos de la presión arterial después de hipoglucemia inducida por insulina en pacientes que recibían Propranolol. Usar con precaución en pacientes con enfermedad vascular periférica (los betabloqueadores pueden agravar



la insuficiencia arterial); emplear con cuidado en individuos con disfunción renal o hepática; considerar reducción de la dosis en pacientes con insuficiencia hepática. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Fenobarbital, Rifampicina y otros inductores enzimáticos pueden aumentar la depuración de Propranolol y disminuir su actividad; Amiodarona, Cimetidina, Ciprofloxacina, Fluconazol, Fluoxetina, Fluvoxamina, Imipramina, Isoniazida, Paroxetina, Quinidina, Ritonavir, Tenipósido, Teofilina, Tolbutamida y Zileutón pueden incrementar los niveles séricos o la toxicidad de Propranolol. (Lacy, 2011).

Éste aumenta de manera significativa los niveles séricos o la toxicidad de Propafenona, Teofilina, Lidocaína, Nifedipina, Diacepam, Tioridazina, Warfarina. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: hipotensión, alteración de la contractilidad miocárdica, ICC, bradicardia, agravamiento de los trastornos de la conducción AV. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: mareo, insomnio, sueños vividos, letargo, depresión, fatiga, mareo. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: hipoglucemia [también atenúa los signos de hipoglucemia (p. ej., taquicardia)], hiperglucemia, hiperpotasemia. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, vómito, diarrea, molestias gastrointestinales, constipación. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: agranulocitosis. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: elevación de enzimas hepáticas. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: debilidad. (Taketomo, 2009).

Respiratorias: broncoespasmo. (Taketomo, 2009).

Diversas: extremidades frías. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **C** (según el fabricante); **D** (en el 2º y 3er trimestres, según análisis experto). (Lacy, 2011).

INTOXICACION Y SU TRATAMIENTO:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, llame a un Centro de Control de Envenenamientos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Síntomas: bradicardia, mareos, grave o desmayo, hipotensión, latido del corazón irregular, dificultad al respirar, uñas de color azul o las palmas de las manos, o convulsiones. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento:

Disminución de la absorción: lavado gástrico y administración de Carbón Activado. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento específico:

Atropina: se pueden administrar para la bradicardia grave en presencia de hipotensión. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Diazepam o Lorazepam: Puede ser usado por vía intravenosa para tratar las convulsiones asociadas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1415-1417.

3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1084.

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 611.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial

RABEPRAZOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Rabeprazol.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas recubiertas.

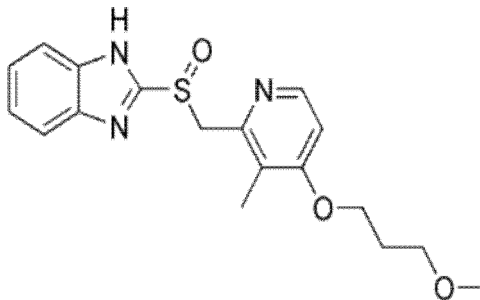
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Pariprazol. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente gastrointestinal para el tratamiento de úlcera gástrica o duodenal; Inhibidor de la bomba de protones; Inhibidor de la secreción de ácido gástrico. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Tratamiento a corto plazo (4 a 8 semanas) y de mantenimiento en la enfermedad por reflujo gastroesofágico (GERD) erosiva o ulcerativa; GERD sintomática; tratamiento a corto plazo (hasta 4 semanas) de úlceras duodenales; tratamiento prolongado de trastornos hipersecretorios patológicos, incluido el síndrome de Zollinger-Ellison; erradicación de *H. pylori* (en el esquema combinado). (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

Suprime la secreción gástrica de ácido por inhibición de la enzima $H^+/K^+-ATPasa$, o bomba de protones, de la membrana de las células parietales; muestra actividad antimicrobiana contra *Helicobacter pylori*. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Inicio de acción:** en 1 h. (Lacy, 2011).
- **Duración:** 24 h. (Lacy, 2011).
- **Absorción:** oral: buena en 1 h. (Lacy, 2011).



- **Unión a proteínas, séricas:** aproximadamente 96%. (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático a través de CYP3A y 2C19 hasta metabolitos inactivos. (Lacy, 2011).
- **Biodisponibilidad: oral:** 52%. (Lacy, 2011).
- **Vida media, eliminación (dependiente de la dosis):** 1 a 2 h. (Lacy, 2011).
- **Tiempo de concentración, plasma:** 2 a 5 h. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** en orina (90%, principalmente como metabolitos tioéter del ácido carboxílico); el resto en heces. (Lacy, 2011).

DOSIS:

Oral: adultos.

ERGE, úlceras, esofagitis:

Curación de ERGE erosiva o ulcerosa: 20 mg/día durante cuatro a ocho semanas; pueden considerarse ocho semanas adicionales en los pacientes sin cicatrización al cabo de ocho semanas de tratamiento. (Lacy, 2011).

Mantenimiento de la curación de ERGE erosiva o ulcerosa: 20 mg/día. (Lacy, 2011).

Tratamiento de ERGE sintomática o úlcera duodenal: 20 mg/día por cuatro semanas. (Lacy, 2011).

Trastornos Hipersecretorios patológicos: 60 mg/día para empezar; ajustar la dosis de acuerdo con la respuesta del paciente; se han utilizado dosis de 100 mg/día y 60 mg dos veces/día; los ciclos de tratamiento han continuado hasta un año. (Lacy, 2011).

Tratamiento activo de úlcera duodenal relacionada con *Helicobacter pylori* (en combinación con Amoxicilina y Claritromicina): 20 mg dos veces al día durante siete días. (Lacy, 2011).

Sin alergia a la Penicilina: 20 mg cada 12 h administrados con 1000 mg de Amoxicilina y 500 mg de Claritromicina cada 12 h durante 10 a 14 días. (Lacy, 2011).

Con alergia a la Penicilina: 20 mg cada 12 h administrados con 500 mg de Claritromicina y 500 mg de Metronidazol cada 12 h durante 10 a 14 días o 20 mg 1 o 2 veces/día administrados con 525 mg de Subsalicilato de Bismuto y 250 mg de Metronidazol más 500 mg de Tetraciclina cada 6 h durante 10 a 14 días. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: Antecedentes de trastornos tromboembólicos



venosos actuales (incluidos DVT, PE y trombosis venosa retiniana); embarazo o mujeres que puedan embarazarse; alimentación al seno materno. (Lacy, 2011).

Precauciones: Usar con cautela en pacientes con alteración hepática grave. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

El Rabeprazol inhibe el metabolismo oxidativo y la absorción del fármaco puede aumentar o disminuir por incremento de los valores del pH gástrico; su potencial total de interacciones con fármacos específicos aún no se determina; puede disminuir la absorción de Indinavir, Ketoconazol e Itraconazol; es posible que aumente la absorción de digoxina. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: dolor torácico, hipertensión, infarto miocárdico, síncope, angina, palpitaciones, bradicardia, taquicardia. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: cefalea, fiebre, escalofríos, malestar general, migraña, insomnio, ansiedad, mareo, depresión, nerviosismo, somnolencia, vértigo, convulsiones, sueños anormales. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: fotosensibilidad, exantema, prurito, urticaria, alopecia. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: hipertiroidismo, hipotiroidismo, ganancia o pérdida ponderal, gota. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: diarrea, náusea, dolor abdominal, vómito, dispepsia, flatulencia, constipación, xerostomía, eructos, gastroenteritis, melena, anorexia, colelitiasis, estomatitis, disfagia, gingivitis, colecistitis, heces anormales, colitis, glositis, pancreatitis, proctitis. (Taketomo, 2009).

Genitourinarias: cistitis, poliaquiuria, disuria, poliuria, dismenorrea. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: anemia. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: rigidez cervical, mialgias, artritis, calambres en piernas, dolor óseo, artrosis, bursitis, neuropatía, parestesias, temblor. (Taketomo, 2009).

Oculares: xeroftalmía, visión anormal, glaucoma. (Taketomo, 2009).

Óticas: otitis media, tinitus. (Taketomo, 2009).

Renales: cálculos renales. (Taketomo, 2009).



Respiratorias: disnea, asma, laringitis, hiperventilación, hipoventilación. (Taketomo, 2009).

Diversas: reacciones de hipersensibilidad. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **B**. (Lacy, 2011).
- **Interacción con alimentos:** los de abundante contenido de grasa pueden retrasar la absorción, pero $C_{máx}$ y AUC no se alteran. (Lacy, 2011).

INTOXICACION Y SU TRATAMIENTO:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, llame a un centro de control de envenenamiento. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Síntomas: No se observaron signos clínicos o síntomas asociados con la sobredosis de hasta 80 mg. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento de sobredosis
No existe un antídoto específico para Rabeprazol. El tratamiento es esencialmente sintomático y de apoyo. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Los pacientes en quienes se

confirma o sospecha de sobredosis intencional deben ser referidos a consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2548-2549.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1434-1436.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1099-1101.



RAMIPRIL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Ramipril.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas y cápsulas.

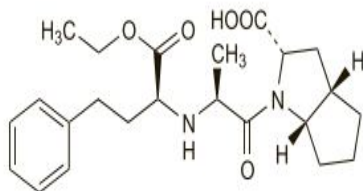
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Éster 1-etílico del ácido (2S, 3aS, 6aS)-1-[[[(S)-N-(S)-1-carboxi-3-fenilpropil]alanil] octahidrocidopenta [b]pirrol-2-carboxílico.(Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Inhibidor de la enzima convertidora de angiotensina (ECA).(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Se utiliza en el tratamiento de la hipertensión, insuficiencia cardíaca, y después de infarto de miocardio

ayudando a mejorar la supervivencia en pacientes con evidencia clínica de insuficiencia cardíaca. También se utiliza para reducir el riesgo de enfermedades cardiovasculares, eventos en pacientes con ciertos factores de riesgo.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Ramipril debe su actividad a ramiprilato en lo que es convertido después de dosis orales.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

En el tratamiento de la hipertensión se administra solo o en combinación con diuréticos tiazídicos, también se utiliza en el tratamiento de disfunción ventricular izquierda después de IM.(Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: el Ramipril es un inhibidor de la ECA que previene la formación de angiotensina II de la angiotensina I. el Ramipril debe someterse a saponificación enzimática por esterases en el hígado a su metabolito biológicamente activo



ramiprilat. Los efectos farmacodinámicos del Ramipril resultan de la elevada afinidad, competitividad y unión inversa del ramiprilat a enzima convertidora de angiotensina, por tanto prevé la formación del potente vasoconstrictor angiotensina II. Este complejo inhibidor enzimático isomerizado tiene un índice de disociación lento, lo cual resulta en una elevada potencia y prolonga la duración de acción. También puede estar involucrado un efecto hipotensivo, pues la angiotensina II incrementa el flujo adrenérgico de salida del SNC; las calicreninas pueden estar disminuidas en la conversión a hormonas activas por los inhibidores de la ECA, por lo tanto reducen la presión arterial.(Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** tras la absorción oral, se absorbe como mínimo entre el 50-60%.(Martindale, 2009).
- **Unión a proteínas:** alrededor de un 56% de ramiprilat se une a proteínas plasmáticas.(Martindale, 2009).
- **Metabolismo:** el Ramipril se metaboliza en el hígado a Ramiprilat.(Martindale, 2009).
- **Vida media:** la semivida efectiva para acumulación de ramiprilat es de 13-17 horas tras varias dosis

de 5-10 mg de Ramipril, pero es mucho más larga para dosis de 1.25-2.5 mg/día.(Martindale, 2009).

- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** las concentraciones plasmáticas máximas del ramiprilat se obtienen antes de 2-4 horas tras una dosis oral de ramipril.(Martindale, 2009).
- **Excreción:** hasta un 60% de la dosis oral del Ramipril se excreta en orina; el resto lo hace en las heces.(Martindale, 2009).

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Dosisusual para adultos

Antihipertensivo:

Inicial: oral, de 2.5 a 20 mg una vez al día, la dosis se ajusta de acuerdo con la respuesta clínica.

Mantenimiento: oral, 2.5 a 20 mg una vez al día o dividido en dosis iguales.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: una dosis inicial de 1.25 mg debe ser utilizada en pacientes que presentan empobrecimiento de sodio y agua como resultado de una terapia diurética previa, los pacientes siguen recibiendo terapia diurética o en pacientes con un aclaramiento de creatinina inferior a 40 ml por



minutor por 1,73m2. Estos pacientes deben mantenerse bajo supervisión médica durante al menos dos horas después de la dosis inicial (y durante una hora adicional después que la presión arterial se haya estabilizado), para detectar hipotensión excesiva.

La dosificación puede ajustarse de manera ascendente lentamente hasta que el control adecuado de la presión arterial se alcance a una dosis diaria total máxima de 5 mg. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Insuficiencia cardíaca congestiva, post infarto de miocardio:

Inicial: Oral, 2.5 mg dos veces al día, la dosificación se ajusta lentamente de acuerdo con la respuesta clínica.

Mantenimiento: Oral, 5 mg dos veces al día. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: un paciente que presenta hipotensión la dosis inicial puede cambiarse a 1.25 mg dos veces al día, luego se valora la dosis diana de 5 mg dos veces al día. Estos pacientes deben mantenerse bajo supervisión durante al menos una hora después de tomar el medicamento y una hora adicional después que la presión arterial se haya estabilizado. Para los pacientes con insuficiencia cardíaca y compromiso renal, la dosis inicial recomendada es de 1.25 mg una vez al día de Raprimil. Seguidamente la dosis se puede

incrementar de 1,25 mg dos veces al día hasta una dosis máxima de 2,5 mg dos veces al día, dependiendo de la respuesta clínica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: hipersensibilidad a Ramipril o a cualquier componente de la formulación; antes de la hipersensibilidad a inhibidores de la ECA. (Lacy, 2011).

Precauciones: pueden ocurrir reacciones anafilácticas con inhibidores de la ECA. Puede ocurrir angioedema en cualquier momento durante el tratamiento (sobre todo después de la primera dosis) con inhibidores de la ECA; puede involucrar cabeza y cuello (compromete de manera potencial al vía aérea) o el intestino (con dolor abdominal). Los afroamericanos y pacientes con angioedema idiopático o hereditario pueden tener un aumento del riesgo. Puede ser necesaria la vigilancia prolongada, sobre todo si la lengua o la laringe están involucradas, pues están asociadas con obstrucción de la vía aérea. Los pacientes con antecedentes de cirugía de la vía aérea pueden estar en riesgo elevado de obstrucción de vías aéreas. El empleo en pacientes con angioedema previo asociado con inhibidor de la ECA está contraindicado. (Lacy, 2011).

Puede ocurrir hipotensión sintomática con o sin síncope con



inhibidores de la ECA (casi siempre con las primeras dosis); los efectos son observados con más frecuencia en pacientes deficientes en volumen. Usar con cautela en miocardiopatía hipertrófica con obstrucción del tracto de salida, estenosis aórtica grave o antes, durante o justo después de cirugía mayor.

Puede ocurrir hiperpotasemia con inhibidores de la ECA, los factores de riesgo que pueden incluir: disfunción renal, diabetes mellitus, uso simultáneo de diuréticos ahorradores de potasio, suplementos de potasio o sales que contengan potasio. Emplear con cautela con estos agentes y vigilar el potasio de manera cercana. (Lacy, 2011).

Puede estar asociado con deterioro de la función renal y/o incrementos de creatinina en suero, de manera particular en pacientes con bajo flujo sanguíneo renal cuyo índice de filtración glomerular depende de la vasoconstricción arteriolar eferente por la angiotensina II; el deterioro puede resultar en oliguria, insuficiencia renal aguda y azoemia progresiva. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Nota: no se conocen interacciones que recomienden evitar el uso concomitante.

Aumento del efecto: Ramipril puede incrementar las concentraciones o efectos de:

Alopurinol, Amifostina, antihipertensores, Azatioprina, Ciclosporina, Ciclosporina (sistémica), Gluconato férrico, Tiomalato sódico de oro, agentes hipotensores, complejo Hierro Dextrano, Litio, Rituximab.

Las concentraciones o efectos del Ramipril pueden estar aumentados por: bloqueadores del receptor de la angiotensina II, diazóxido, eplerenona, diuréticos de asa, inhibidores de la MAO, pentoxifilina, inhibidores de la fosfodiesterasa 5, sales de potasio, diuréticos ahorradores de potasio, análogos de la Prostaciclina, Sirolimus, Telmisartán, Temsirolimus, diuréticos tiacídicos, Tolvaptán, Trimetoprim. (Lacy, 2011).

Disminución del efecto: las concentraciones o efectos del Ramipril pueden estar disminuidos por: antiácidos, Aprotinina, Metilfenidato, agentes antiinflamatorios no esteroideos, Salicilatos, Yohimbina. (Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Valores de pruebas de laboratorio: pueden ocurrir pequeños incrementos en creatinina sérica después de iniciar, así como también de BUN; tomar en consideración la suspensión solo en pacientes con deterioro progresivo o significativo de la función renal. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:



Respiratorias: tos frecuente.(Lacy, 2011).

Cardiovasculares: hipotensión, angina, hipotensión postural, síncope.(Lacy, 2011).

Sistema nervioso central:cefalea, mareo, fatiga, vértigo.(Lacy, 2011).

Gastrointestinales:nausea, vómito.(Lacy, 2011).

Endocrinas y metabólicas:hiperpotasemia.(Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: dolor torácico (no cardíaco).(Lacy, 2011).

Renales: disfunción renal, creatinina en suero aumentada., BUN aumentado, puede ocurrir incrementos transitorios de creatinina y/o BUN con más frecuencia.(Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C** (primer trimestre); **D** (segundo y tercer trimestre).(Lacy, 2011).
- Lactancia: se desconoce la excreción en leche materna, no se recomienda.(Lacy, 2011).
- El Ramipril cruza la placenta.(Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

El empleo concurrente de bloqueadores del receptor de la angiotensina puede incrementar el riesgo de eventos adversos.(Lacy, 2011).

Las toxicidades asociadas con inhibidores de la ECA incluyen ictericia colestásica (la cual puede progresar a necrosis hepática fulminante), agranulocitosis, neuropenia o leucopenia con hipoplasia mieloide. Los pacientes con enfermedades vasculares de la colágena (sobre todo con disfunción renal concomitante) o disfunción renal sola pueden tener aumento del riesgo de toxicidad hematológica.(Lacy, 2011).

Tratamiento de la sobredosis: Debe comunicarse con un centro de atención para intoxicaciones.

En caso de sobredosis o intoxicación, el tratamiento depende de la forma y momento de la ingestión y del tipo y gravedad de los síntomas. Además de las medidas generales (prevención de la absorción mediante lavado gástrico y administración de carbón activado, aceleración del paso con sulfato de sodio), se deben monitorizar los signos vitales y aplicar medidas de apoyo,



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



requiriéndose en ocasiones cuidados intensivos. El componente Ramipril raramente puede eliminarse mediante diálisis.(Lacy, 2011).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 205-206.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp.Pp. 1440-1442.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1385-1386.



RANITIDINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Ranitidina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.
Solución inyectable.

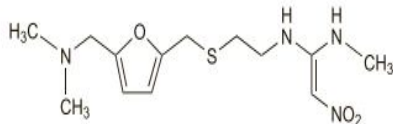
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Clorhidrato de Ranitidina.(Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente gastrointestinal para el tratamiento de úlcera gástrica o duodenal; antagonista de histamina H2.(Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento a corto plazo de úlceras duodenales activas y úlceras gástricas benignas; prevención a

largo plazo de úlcera duodenal y estados de hipersecreción gástrica; enfermedad por reflujo gastroesofágico (ERGE); úlcera posoperatoria recurrente; terapéutica y prevención de esofagitis erosiva; hemorragia gastrointestinal proximal, prevención de neumonitis por broncoaspiración de ácido durante intervención quirúrgica y prevención de úlceras por estrés. También es utilizado para el alivio de pirosis, dispepsia y dolor estomacal.(Taketomo, 2009)

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: produce inhibición competitiva de la histamina en los receptores H2 de las células parietales gástricas, lo que inhibe la secreción de ácido gástrico.(Taketomo, 2009)

FARMACOCINÉTICA:

- **Distribución:** penetra en grado mínimo la barrera hematoencefálica, V_d : niños: 1 a 1.3 L/Kg, Adultos: 1.4 L/Kg.(Taketomo, 2009)
- **Unión a proteínas:** 15%.(Taketomo, 2009)
- **Metabolismo:**en el hígado.(Taketomo, 2009)
- **Biodisponibilidad:** Oral: 50%



IM: 90 a 100%. (Taketomo, 2009)

- **Vida media:**

Niños: 3.5 a 16 años: 1.8 a 2 horas.

Adultos: función renal y hepática normales: 2 a 2.5 horas; disfunción renal (Dcr 25 a 35 mL/min): 4.8 horas. (Taketomo, 2009)

- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:**

Oral: 1 a 3 horas.

IM: 15 minutos. (Taketomo, 2009)

- **Excreción:** 30% (oral) o 70% (IV) se elimina como fármaco sin cambios en orina y heces. (Taketomo, 2009)

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Nota: la dosificación y puntos fuertes de las formas de dosificación disponibles se expresan en términos de Ranitidina base (no la sal de hidrocloreuro).

Adultos y adolescentes:

Úlcera duodenal:

Tratamiento: Oral, 150 mg dos veces al día o 300 mg a la hora de acostarse.

Profilaxis de la úlcera duodenal recurrente: Oral, 150 mg en la hora de acostarse.¹

Úlcera gástrica activa, benigna:

Tratamiento: administración oral, 150 mg dos veces al día.

Profilaxis de la úlcera gástrica recurrente: Oral, 150 mg antes de acostarse. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Condiciones gástricas hipersecretoras:

Oral, 150 mg dos veces al día, la dosis se ajusta según sea necesario y gramos por día se han utilizado en los casos graves. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Reflujo gastroesofágico:

Oral, 150 mg dos veces al día.
Nota: La dosis oral recomendada para la esofagitis erosiva es de 150 mg cuatro veces al día.

Nota: para pacientes con deterioro de la función renal (aclaramiento de creatinina inferior a 50 ml por minuto) dosis oral de 150 mg cada veinticuatro horas, la frecuencia de la dosis se aumenta a cada doce horas o más frecuentemente si es necesario. Las reducciones en las dosis también pueden ser necesarias si la función hepática está presente. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Dosis pediátrica:



Úlcera duodenal o úlcera gástrica:

Oral, 2 a 4 mg por kg de peso corporal, dos veces al día hasta una dosis máxima de 300 mg por día.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Reflujo gastroesofágico:

Oral, 2 a 8 mg por kg de peso corporal por dosis tres veces al día.

Nota: En ciertas circunstancias, la dosis puede ser ajustada basada en el pH gástrico.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS INYECTABLE:

Adultos y adolescentes:

Úlcera duodenal o úlcera gástrica o condiciones gástricas hipersecretoras y la profilaxis de hemorragia relacionada con el estrés la mucosa:

Intramuscular: 50 mg cada seis a ocho horas.

Intravenosa: 50 mg cada seis a ocho horas, se diluye a un volumen total de 20 ml con una solución intravenosa compatible y administrarse durante un período de no menos de cinco minutos.

Infusión intravenosa: 50 mg cada seis a ocho horas, se diluye en 100 ml de una solución intravenosa compatible y administrada durante un período de quince a veinte

minutos.

Infusión continua intravenosa: 6.25 mg por hora, se diluye en una solución intravenosa compatible.

Nota: para las condiciones hipersecretoras gástricas, la infusión debe iniciarse de 1 mg por kg de peso corporal por hora y se incrementa en 0,5 mg por Kg de peso corporal por hora (si la producción de ácido gástrico es mayor que 10 mEq por hora o el paciente está sintomático), hasta 2.5 mg por kg de peso corporal por hora.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Profilaxis en neumonía por aspiración:

Inyección intramuscular o intravenosa lenta: 50 mg administrados cuarenta y cinco hasta sesenta minutos antes de la inducción de la anestesia general.¹

Nota: para los pacientes con deterioro de la función renal (aclaramiento de creatinina inferior a 50 ml por minuto): intravenosa, 50 mg cada dieciocho a veinticuatro horas, la frecuencia de la dosis se aumenta a cada doce horas o más frecuentemente, si fuera necesario, la reducción de la dosis puede ser necesaria si hay insuficiencia de la función hepática.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Límite de prescripción en un adulto: 400 mg al día.

Dosis pediátrica:

Úlcera duodenal o úlcera gástrica:

infusión intravenosa: 2 a 4 mg por kilogramo de peso corporal al día, se diluye a un volumen adecuado con una solución intravenosa compatible y se administra durante un período de quince a veinte minutos período.

Reflujo gastroesofágico:

infusión intravenosa: 2 a 8 mg por kg de peso corporal, diluido en un volumen adecuado con una solución intravenosa compatible y se administra durante un período de quince a veinte minutos, tres veces al día.

Nota: En ciertas circunstancias, la dosis puede ser ajustada basada en el pH gástrico.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

hipersensibilidad a Ranitidina, cualquier componente de la fórmula u otros antagonistas H₂; pacientes con antecedente de porfiria aguda (puede desencadenar un ataque agudo).(Taketomo, 2009).

Precauciones: usar con cautela en pacientes con disfunción hepática y renal; es necesario modificar la

dosificación en pacientes con disfunción renal.(Taketomo, 2009).

El uso de inhibidores del ácido gástrico, que incluyen inhibidores de la bomba de protones y bloqueadores H₂, se relaciona con incremento del riesgo de desarrollar gastroenteritis aguda y neumonía adquirida en la comunidad.

La administración IV rápida de Ranitidina se vincula con bradicardia, sobre todo en individuos predispuestos a trastornos de la frecuencia cardiaca.(Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante de Ranitidina con Delavirdina, Erlotinib.(Lacy, 2011).

Aumento del efecto: Ranitidina puede incrementar las concentraciones o el efecto de Procaïnãmida, Saquinavir, Sulfonilureas, Warfarina.(Lacy, 2011).

Las concentraciones o efectos de la Ranitidina pueden aumentar por: inhibidores de la P-glucoproteína.²

Disminución del efecto: la Ranitidina puede disminuir las concentraciones o efectos de agentes antimicóticos (derivados azoles, sistémicos), Atazanavir, Cefpodoxima, Cefuroxima, Dasatinib, Delavirdina, Erlotinib, Fosamprenavir, Gefitinib, Indinavir, sales de Hierro, Mesalamina, Nelfinavir, Prasugrel.(Drug



Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Las concentraciones o efectos de la Ranitidina pueden disminuir por: peginterferón alfa-2b, inductores de P-glicoproteína.(Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Valores de pruebas de laboratorio: Puede existir alteraciones en las pruebas de laboratorio como aumentar glutamil transpeptidasa.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Proteína en orina falsas positiva; prueba de secreción de ácido gástrico, prueba dérmica de extractos de alérgenos.(Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares:bradicardia, taquicardia, vasculitis (rara).(Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: mareo, sedación, malestar general, confusión, cefalea, alucinaciones, ansiedad.(Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: constipación, náusea, vómito, malestar abdominal, pancreatitis (rara).(Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: ginecomastia.(Taketomo, 2009)

Dermatológicas: exantema, alopecia (rara), eritema multiforme (raro).(Taketomo, 2009).

Hematológicas: trombocitopenia, anemia aplásica (rara), granulocitopenia, leucopenia.(Taketomo, 2009).

Hepáticas: hepatitis.(Taketomo, 2009).

Locales: dolor transitorio en el sitio de la inyección.(Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: artralgias.(Taketomo, 2009).

Renales: elevación de creatinina sérica.(Taketomo, 2009).

Respiratorias: neumonía (la relación causal aún no se establece).(Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **B**.(Taketomo, 2009).
- Lactancia: se excreta en la leche materna/valorar con cautela antes de prescribir.(Taketomo, 2009).
- Produce un pequeño y transitorio incremento en la concentración de prolactina (con inyección IV).(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Este es un medicamento que reporta baja toxicidad.

En caso de intoxicación accidental se debe de proceder a realizar un lavado gástrico y tratamiento sintomático, sobre todo de las arritmias. Se elimina por hemodiálisis.

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional (27 edici) USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 1667-1670.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1443-1445.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1766-1768.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1100-1102.



RIBAVIRINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Ribavirina.

FORMA FARMACEUTICA:

Cápsulas.
Tabletas.
Solución oral.

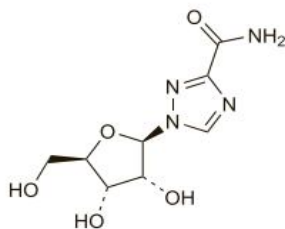
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

1 β -D-Ribofuranosil-1H-1,2,4-triazol-3-carboximida.(Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antiviral.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Inyección para el tratamiento de hepatitis C crónica en combinación con interferón alfa-2b en pacientes con hepatopatía compensada que

recidivan después de terapia con alfa interferón o sin tratamiento previo con alfa interferones.

Inyección para el tratamiento de hepatitis C crónica en combinación con peginterferón alfa-2b en pacientes con hepatopatía compensada sin tratamiento previo con alfa interferones.(Lacy, 2011).

Solución oral: inyección para el tratamiento de hepatitis C crónica en combinación con interferón alfa-2b en pacientes con hepatopatía compensada que no fueron tratados con anterioridad con alfa interferones o pacientes que recibieron después de la terapia con interferón alfa.(Lacy, 2011).

Inyección para el tratamiento de hepatitis C crónica en combinación con peginterferón alfa-2^a en pacientes con hepatopatía compensada que no fueron tratados con anterioridad con interferones alfa.(Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: inhibe la replicación de ARN y ADN virales; inhibe la actividad de la polimerasa de ARN del virus de la influenza e interfiere en la expresión del ARN mensajero, con que inhibe la síntesis de proteínas virales.(Taketomo, 2009).

3^a Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** se absorbe rápidamente después de su administración oral. (Martindale, 2009).
- **Distribución:** con la administración oral a largo plazo, la Ribavirina se distribuye con lentitud hacia el líquido cefalorraquídeo. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** ocurre en el interior de las células y puede ser necesario para la acción del fármaco; se metaboliza en el hígado en Ribavirinadesribolisada (metabolito activo). (Taketomo, 2009).
- **Biodisponibilidad:** después de su administración por vía oral es del 50% como resultado del metabolismo del primer paso. (Martindale, 2009).
- **Vida media:** Niños: 6.5 a 11 horas.
Adultos: 24 a 36 horas después de una dosis única; su vida media es más prolongada en el eritrocito (16 a 40 días), que puede utilizarse como marcador del metabolismo intracelular; su vida media terminal después de dosis múltiples es de 151 horas. (Taketomo, 2009).

- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:**

Capsulas 3 horas y tabletas 2 horas. (Taketomo, 2009).

- **Excreción:** el metabolismo hepático es la principal vía de eliminación con 40% del fármaco depurado por vía renal sin cambios y como metabolitos. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Dosis usual para adultos: (capsulas orales)

Hepatitis C crónica (en combinación con interferón alfa-2b):

Menor o igual a un peso de 75 Kg: 400 mg en la mañana y 600 mg en la noche.

Mayor a un peso de 75 Kg: 600 mg dos veces al día. (Taketomo, 2009).

Hepatitis C crónica (en combinación con peginterferón alfa-2b):

400 mg dos veces al día. (Taketomo, 2009).

Dosis usual para adultos: (tabletas orales)

Hepatitis C crónica, genotipo 1,4 (en combinación con interferón alfa-2a pegilado):

Menor a un peso de 75 Kg: 500 mg dos veces al día por 48 semanas.



Mayor o igual a un peso de 75 Kg:
600 mg dos veces al día por 48
semanas.(Taketomo, 2009).

**Hepatitis C crónica, genotipo 2, 3
(en combinación con interferón
alfa-2a pegilado):**

400 mg dos veces al día por 24
semanas.(Taketomo, 2009).

**Hepatitis C crónica en pacientes
con infección concurrente por
VIH (en combinación con
interferón alfa-2a pegilado):**

400 mg dos veces al día por 48
semanas, sin importar el
genotipo.(Taketomo, 2009).

**Dosis pediátrica: (capsulas o
solución oral)**

**Niños mayores o igual a 3 años:
hepatitis C crónica (en
combinación con interferón alfa-
2b):**

15 mg/Kg/día divididos en dos
fracciones (en la mañana y en la
noche).

Con un peso de 25 a 36 Kg: 200 mg
dos veces al día.

Con un peso de 37 a 49 Kg: 200
mg en la mañana y 400 mg en la
noche.

Con un peso de 50 a 61 Kg: 400 mg
dos veces al día; con un peso
mayor a este se utiliza la dosis para
adultos.(Taketomo, 2009).

**CONTRAINDICACIONES Y
PRECAUCIONES:**

Contraindicaciones:hipersensibilid
ad a la Ribavirina o cualquier
componente de la fórmula.

Esta contraindicado en hombres
cuyas parejas están embarazadas;
pacientes con hemoglobinopatías;
hepatitis autoinmunitaria; como
monoterapia para tratamiento de
hepatitis C crónica; pancreatitis;
individuos con cardiopatía
significativa o inestable; Dcr menor
a 50 mL/min; administración
concomitante con Didanosina (se
informan casos de insuficiencia
hepática mortal, neuropatía
periférica e hiperlactemia y acidosis
láctica).(Taketomo, 2009).

Contraindicaciones adicionales para
la tableta de Ribavirina en
combinación con peginterferón alfa-
2a: insuficiencia hepática en
cirróticos monoinfectados con
hepatitis C crónica antes o durante
el tratamiento, insuficiencia hepática
en cirróticos con hepatitis C crónica
e infección concurrente con VIH
antes o durante el
tratamiento.(Taketomo, 2009).

Precauciones: usar con precaución
en pacientes con cardiopatía,
individuos con infiltrados
pulmonares o deterioro de la función
pulmonar (vigilar de cerca) o
personas con sarcoidosis (podría
agravarse).(Taketomo, 2009).

La Ribavirina es potencialmente
matágena, promotora de tumores y
gonadotóxica; puede causar
defectos del nacimiento, muerte
fetal o ambos.(Taketomo, 2009).

La Ribavirina en solución oral
contiene benzoato de sodio; el ácido
benzoico (benzoato) es un
metabolito del alcohol bencílico;
dosis altas de alcohol bencílico



(mayor o igual a 99 mg/Kg/día) se relacionan con toxicidad potencialmente mortal (síndrome de jadeo) en recién nacidos; el síndrome de jadeo consiste en acidosis metabólica, dificultad respiratoria, respiración jadeante, disfunción de SNC (que incluye convulsiones, hemorragia intracraneal), hipotensión y colapso cardiovascular. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Zidovudina: en estudios in vitro han demostrado que cuando se combinan Ribavirina y Zidovudina, reproducibles antagónicos y no debe ser utilizado al mismo tiempo; Ribavirina inhibe la fosforilación de la Zidovudina a su forma activa trifosfato. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Reacciones adversas documentadas mientras se recibe tratamiento de combinación con Interferón alfa-2b:

Cardiovasculares: infarto miocárdico, dolor torácico, arritmias. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: depresión, ideación suicida, fiebre, labilidad emocional, insomnio, irritabilidad, dificultad para la concentración, cefalea, fatiga, mareo, astenia. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, anorexia, dispepsia, vómito, diarrea sanguinolenta, disgeusia, pancreatitis, hemorragia gastrointestinal. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: diabetes. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: exantema, alopecia, prurito, urticaria, angiedema. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: anemia hemolítica (la disminución máxima de hemoglobina suele ocurrir durante las primeras ocho semanas de tratamiento con Ribavirina), neutropenia, leucopenia, trombocitopenia. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: insuficiencia hepática. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: mialgias, artralgias, debilidad, dolor, neuropatía periférica. (Taketomo, 2009).

Respiratorias: disnea, tos, faringitis, congestión nasal, sinusitis, infiltrados pulmonares. (Taketomo, 2009).

Diversas: síntomas semejantes a influenza, anafilaxia, infección bacteriana, trastornos autoinmunitarios. (Taketomo, 2009).

Nota: fiebre, anemia, vómito, labilidad emocional e ideación suicida ocurren con mayor frecuencia en pacientes pediátricos que reciben Ribavirina oral con



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos

CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



interferón alfa, en comparación con adultos.(Taketomo, 2009).

DIVol. I (27 edición).
Estados Unidos: Editorial
Massachusetts Micromedex. Pp.
2585-2592.

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: X.(Taketomo, 2009).
- Lactancia: se desconoce si se excreta en la leche materna por lo que no se recomienda.(Taketomo, 2009).
- El embarazo debe evitarse en parejas en las que el hombre reciba Ribavirina por vía oral, se recomienda emplear un método anticonceptivo eficaz después de finalizado el tratamiento durante 4 meses en mujeres y durante 7 meses en hombres. Los pacientes hombres cuya pareja esta embarazada deben utilizar un preservativo para minimizar la exposición vaginal a la Ribavirina.(Martindale, 2009).

2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp.Pp. 1459-1462.

3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 902-904.

4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1105-1108.

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

En humanos, dosis de 12.6 g diarios durante 7 días sólo produjeron una anemia moderada, reversible al suspender el medicamento.

En caso de sobre dosis comuníquese con el centro de control de sustancias tóxicas.

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



RIBOFLAVINA USP

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Riboflavina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

7,8-dimetil-10-(1-ribitil)isoaloxacina.
(Martindale, 2009).

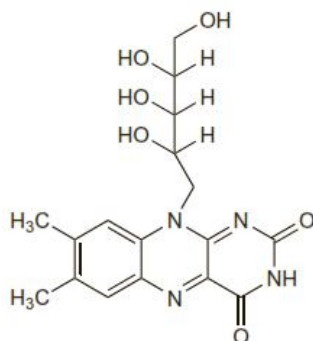
Sinónimos:

Lactoflavina; Vitamina B2; Vitamina G. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Complemento nutricional; Vitamina Hidrosoluble. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Prevención de deficiencia de Riboflavina y tratamiento de arriboflavinosis; anemia microcítica producida por deficiencia de reductasa de glutatión. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de Acción: el fármaco se integra a coenzimas que funcionan como moléculas portadoras de hidrogeno, las cuales son necesarias para la respiración normal de los tejidos; también se requiere para la activación de Piridoxinas y la conversión de Triptófano en Niacina. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** se absorbe con facilidad a través del tubo gastrointestinal; su absorción gastrointestinal disminuye en pacientes con hepatitis, cirrosis u obstrucción biliar. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** el destino metabólico del fármaco se desconoce. (Taketomo, 2009).
- **Vida media, biológica:** 66 a 84 min. (Taketomo, 2009).



- **Eliminación:** 9% se elimina sin cambios en la orina. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

ORAL:

Deficiencia de Rivoflavina:

Niños: 3 a 10 mg/día en fracciones. (Taketomo, 2009).

Adultos: 5 a 30 mg/día en fracciones. (Taketomo, 2009).

Ingesta adecuada:

Lactantes: < 6 meses: 0.3 mg (0.04 mg/kg). (Taketomo, 2009).

RDA:

Niños

1 a 3 años: 0.5 mg

4 a 8 años: 0.6 mg

9 a 13 años: 0.9 mg

14 a 18 años:

Varones: 1.3 mg

Mujeres 1.1 mg. (Taketomo, 2009).

Anemia microcitica relacionada con deficiencia de reductasa de glutatión:

adultos 10 mg diarios durante 10 días. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Rivoflavina o a cualquier componente de la formula. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

No se reconocen interacciones con esta implicación. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Genitourinarias: pigmentación de la orina (amarillo brillante) con dosis altas. (Taketomo, 2009).

REFERENCIAS:

1. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1977
2. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp.1106-1108



RIFAMPICINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Rifampicina.

FORMA FARMACEUTICA:

Suspensión Oral.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

3-[[(4-Metil-1-piperazinil) imino] metil]rifamicina. (Taketomo, 2009).

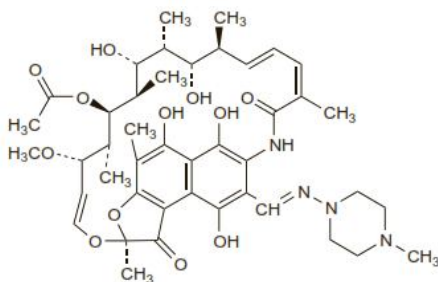
Sinónimos:

Rifampicina Sintética. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente Antifímico, Antibiótico, Diversos. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Se utiliza en combinación con otros medicamentos Antifímicos para tratar tuberculosis activa; eliminación de meningococos en portadores asintomáticos: profilaxis para contactos de pacientes con infección tipo B por Haemophilus influenzae; se emplea en conjunción con otros agentes antibacterianos para el tratamiento de otros agentes antibacterianos para el tratamiento de infecciones estafilocócicas. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de Acción: Inhibe la síntesis bacteriana de ARN al unirse a la subunidad beta de la polimerasa de ARN dependiente de ADN, lo que bloquea la transcripción de ARN. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Duración:** < 24 horas. (Lacy, 2011).
- **Absorción: oral:** se absorbe bien; el alimento puede retrasar o reducir un poco la concentración máxima. (Lacy, 2011).
- **Distribución:** muy lipofílico; cruza bien la barrera hematoencefálica. (Lacy, 2011).



- **Difusión relativa desde la sangre hacia el LCR;** adecuada con o sin inflamación (excede los MIC usuales). (Lacy, 2011).
- **Razón LCR:** concentración en sangre; meninges inflamadas: 25%. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** 80%. (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático; pasa a recirculación enterohepática. (Lacy, 2011).
- **Vida media, eliminación:** 3 a 4 horas, prolongada en disfunción hepática; enfermedad renal en estadio terminal: 1.8 a 11 horas. (Lacy, 2011).
- **Tiempo de concentración sérica máxima:** oral: 2 a 4 horas. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** heces (60 a 65%) y orina aproximadamente (30%) como fármaco sin cambio. (Lacy, 2011).

DOSIS:

ADULTOS:

600 mg cada 24 horas durante 4 días. (Lacy, 2011).

Lepra (uso no autorizado):

Adultos:

Multibacilar: 600 mg 1 vez al mes durante 24 meses en combinación con Ofloxacino y Minociclina. (Lacy, 2011).

Paucibacilar: 600 mg 1 vez al mes durante 6 meses en combinación con Dapsona. (Lacy, 2011).

Lesión única: 600 mg como dosis única en combinación con Ofloxacino 400 mg y Minociclina 100 mg. (Lacy, 2011).

Meningitis (pneumococcus o Staphylococcus) (uso no autorizado): recomendada solo para organismos de susceptibilidad conocida a la Rifampicina y muy resistentes a la Penicilina o Cefalosporinas. Puede emplearse en lugar de o además de Vancomicina con Dexametasona. (Lacy, 2011).

Lactantes y niños: 20 mg/kg/día como dosis única o en 2 dosis divididas; máximo: 600 mg/kg/día. (Lacy, 2011).

Adultos: 600 mg 1 vez/día. (Lacy, 2011).

Profilaxis de meningitis meningocócica (uso no autorizado):

Lactantes < 1 mes: 10 mg/kg/día en dosis divididas cada 12 horas durante 2 días. (Lacy, 2011).

Lactantes 1 mes: 10 mg/kg/día en dosis divididas cada 12 horas durante 2 días (máximo: 600 mg/dosis). (Lacy, 2011).

Portadores nasales de Staphylococcus aureus (uso no autorizado):



Niños: 15 mg/kg/día divididos cada 12 horas durante 5 a 10 días en combinación con otros antibióticos. (Lacy, 2011).

Micobacteria no tuberculosa (M. kansasii) (uso no autorizado): **adultos:** 10 mg/kg/día (máximo: 600 mg/día) por una duración que incluye 12 meses de cultivo negativo de esputo; casi siempre empleada en combinación con Etambutol e Isoniazida. (Lacy, 2011).

Sinergia para infecciones por Staphylococcus aureus (no autorizado): adultos 300 a 600 mg 2 veces al día con otros antibióticos. (Lacy, 2011).

Tuberculosis activa: nota: se prefieren un régimen de 4 fármacos (Isoniazida, Rifampicina, Pirazinamida y Etambutol) para el tratamiento inicial empírico de TB. (Lacy, 2011).

Cuando se dispone de la susceptibilidad al fármaco el régimen debe cambiarse según sea conveniente. (Lacy, 2011).

Lactantes y niños < 12 años:

Tratamiento diario: 10 a 20 mg/kg/día casi siempre como dosis única (máximo 600 mg/día) . (Lacy, 2011).

Tratamiento directamente observado (DOT) 2 veces a la semana: 10 a 20 mg/kg/día (máximo: 600 mg). (Lacy, 2011).

Adultos:

Tratamiento diario: 10 mg/kg/día (máximo: 600 mg/día). (Lacy, 2011).

Tratamiento directamente observado (DOT) 2 veces a la semana: 10 mg/kg/día (máximo: 600 mg); 3 veces/semana: 10 mg/kg (máximo: 600 mg). (Lacy, 2011).

Tuberculosis, infección latente (LTBI): como alternativa a isoniazida:

Niños: 10 a 20 mg/kg/día (máximo 600 mg/día), durante 6 meses. (Lacy, 2011).

Adultos: 10 mg/kg/día (máximo 600 mg/día); durante 4 meses. (Lacy, 2011).

Ajustes de dosis en disfunción hepática: pueden ser necesarias las reducciones de la dosis para reducir hepatotoxicidad. (Lacy, 2011).

Hemodiálisis o diálisis peritoneal: Las concentraciones de Rifampicina en plasma no se afectan de manera significativa por hemodiálisis o diálisis peritoneal. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: Hipersensibilidad a Rifampicina, Rifamicinas o cualquier componente de la fórmula, uso concomitantes con Amprenavir. (Taketomo, 2009).



INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Efectos sobre el metabolismo y transporte sustrato de glucoproteína P, SLCO1B1; inductor de CYP1A2 (potente), CYP2A6 (potente), CYP2B6 (potente), CYP2C8 (potente), CYP2C9 (potente) CYP2C19 (potente), CYP3A4 (potente), glucoproteína P. (Taketomo, 2009).

Evitar uso concomitante de:

Atazanavir, BCG, Dronedarona, Etravirina, Everolimus, Micofenolato, Nilotinib, Pazopanib, Praziquantel, Quinina, Ranolazina, Romidepsina, Tolvaptán, Voriconazol. (Taketomo, 2009).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Resultados del Diagnostico

- Prueba directa de Coombs (antiglobulina) (Puede ser positivo raramente durante la terapia con Rifampicina). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Prueba de supresión con Dexametasona, (La Rifampicina pueden impedir la acción inhibidora de una dosis estándar de Dexametasona administrada para la prueba de supresión durante la noche, alterando una prueba normal, se recomienda que la terapia de Rifampicina se suspenda 15 días antes de administrar la prueba de

supresión con Dexametasona). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Determinaciones de Folato, y determinaciones de Vitamina B12, en el suero sanguíneo:

- (Las concentraciones terapéuticas de Rifampicina pueden interferir con el estándar de los ensayos microbiológicos de Folato y Vitamina B12, los métodos alternativos deben ser considerados en la determinación sérica de Folato y Vitamina B12). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central: estado soporoso, fatiga, confusión, ataxia, fiebre, cefalea, mareo. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: exantema, prurito, urticaria. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, vómito, diarrea, estomatitis, anorexia. (Taketomo, 2009).

Hematológicas; eosinofilia, discrasias sanguíneas (leucopenia, trombocitopenia), anemia hemolítica. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: hepatitis, ictericia colestásica, elevación de enzimas hepáticas (Taketomo, 2009).



Neuromusculares y esqueléticas: mialgias, artralgias, debilidad. (Taketomo, 2009).

Renales: insuficiencia renal con nefritis intersticial. (Taketomo, 2009).

Diversas: síndrome semejante a influenza, pigmentación de líquidos corporales (color anaranjado). (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

El régimen de dos meses de Rifampicina con Pirazinamida para el tratamiento de infección tuberculosa latente (ITBL) se relaciona con daño hepático grave y mortal. La IDSA y los CDC recomiendan que el régimen no se use de manera general en pacientes con ITBL. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Efectos agudos y crónicos:

Obnubilación mental (cambios de personalidad), edema peri orbital o facial (hinchazón alrededor de los ojos o la cara entera), pruritos generalizada (picazón en todo el cuerpo), el síndrome del hombre rojo (decoloración de la piel en rojo o naranja, las membranas mucosas y la esclerótica). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: las muertes son más propensas a ocurrir si hay una enfermedad subyacente hepática, el

uso frecuente o abuso de alcohol o consumo concomitante de otros medicamentos hepatotóxicos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento para la sobredosis de Rifampicina:

Para disminuir la absorción, evacuar el contenido del estómago utilizando Jarabe de Ipecacuana o por lavado gástrico, la administración de una suspensión de Carbón Activado ayudara a disminuir la absorción del tracto gastrointestinal de Rifampicina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp.2600-2601.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1465-1466.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 325.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México:



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Editorial Inter Sistemas. Lexi
Comp. Pp. 1110-1111.

RITONAVIR

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Ritonavir.

FORMA FARMACEUTICA:

Capsulas.

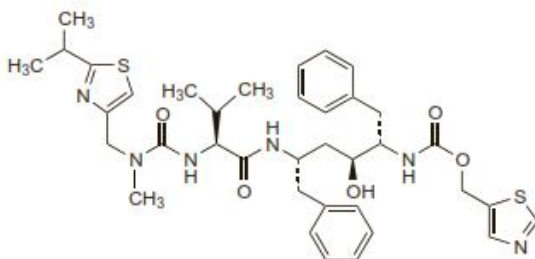
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

5-tiazolilmetil del ácido 10-hidroxi-2-metil-5-(1-metiletil)-1-[2-(1-metiletil)-4-tiazolil]-3, 6-dioxo-8, 11-bis (fenilmetil)-2, 4, 7, 12-tetraazatridecan-13-oico, [5S-(5R*, 8R*, 10R*, 11R*)]. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente Antirretroviral Inhibidor de la Proteasa. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento de infección por VIH; siempre se debe emplear como parte de un régimen multifármacos (por lo menos 3 agentes antirretrovirales); puede usarse como "reforzador farmacocinético para otros Inhibidores de la Proteasa. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de Acción: Se une al sitio de actividad de la proteasa de VIH-1 e inhibe la división de los precursores virales Gag-Pol poliproteínicos en proteínas funcionales individuales requeridas por la infección VIH. Esto resulta en la formación de partículas virales inmaduras no infectantes. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** variable; aumenta con los alimentos. (Lacy, 2011).
- **Distribución:** concentraciones elevadas en suero y nódulos linfáticos. (Lacy, 2011).
- **Vd:** 0.16 a 0.66 L/kg. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** 98 a 99%. (Lacy, 2011).



- **Metabolismo** hepático vía CYP3A4 y 2D6; 5 metabolitos, baja concentración de un metabolito activo (M-2) logrado en plasma (oxidativa). (Lacy, 2011).
- **Vida media, eliminación:** 3 a 5 horas. (Lacy, 2011).
- **Tiempo de concentración máxima, plasma:** solución oral: 2 horas (en ayunas); 4 horas (sin ayuno). (Lacy, 2011).
- **Excreción:** orina aproximadamente (11%; y 4% como fármaco sin cambio); heces aproximadamente (86%; y 34% como fármaco sin cambio). (Lacy, 2011).

DOSIS:

ORAL:

(Usar en combinación con otros agentes antirretrovirales):

Recién nacidos: su empleo no está aprobado; se requieren más estudios. (Lacy, 2011).

Lactantes > 1 mes y niños: inicial: 250 mg/m²/dosis dos veces al día (cada 12 h); aumentar a intervalos de dos o tres días en incrementos de 50 mg/m²/dosis dos veces al día, hasta 350 a 400 mg/m²/dosis dos veces al día; dosis máxima: 600 mg/dosis dos veces al día. (Lacy, 2011).

Nota: los pacientes que no toleran 400 mg/m² dos veces al día (a causa de efectos adversos) pueden tratarse con la dosis más alta tolerada; sin embargo, debe considerarse un agente antirretroviral alternativo. Se obtuvieron niveles séricos comparables a sus observados en adultos que recibían dosis estándar en niños mayores de dos años que recibían 350 a 400 mg/m² dos veces al día. (Lacy, 2011).

En pacientes más pequeños (un mes a dos años), que recibieron 350 o 450 mg/m²/dosis dos veces al día, el ABC de Ritonavir fue 16% menor y las concentraciones mínimas inhibitorias fueron 60% más bajas que las observadas en adultos que recibieron dosis estándar; no se observaron ABC mayores con 450 mg/m²/dosis dos veces al día en comparación con 350 mg/m²/dosis dos veces al día. (Lacy, 2011).

Adolescentes y adultos: 600 mg dos veces al día; puede utilizarse un esquema de ajuste de la dosis para reducir los efectos adversos (náusea o vómito) iniciando el tratamiento con 300 mg dos veces al día; aumentar la dosis 100 mg dos veces al día en el transcurso de dos o tres días, hasta una dosis máxima de 600 mg dos veces al día. (Lacy, 2011).

Adultos: Tratamiento concomitante con Saquinavir: Ritonavir 400 mg dos veces al día con Saquinavir 400 mg dos veces al día. (Lacy, 2011).



Nota: aun cuando la dosis óptima de Ritonavir con Saquinavir aún no se establece, 400 mg de Ritonavir dos veces al día se toleraron mejor que 600 mg dos veces al día Potenciador farmacocinético ("refuerzo con Ritonavir"): el Ritonavir se usa en dosis más bajas para aumentar los niveles séricos de otros inhibidores de la proteasa; dosis usual: 100 mg dos veces al día o 200 mg una vez al día; intervalo: 100 a 400 mg dos veces al día, en combinación con otros inhibidores de la proteasa; véanse las monografías individuales para buscar las dosis recomendadas de inhibidores de la proteasa. (Lacy, 2011).

Nota: las dosis de refuerzo pediátricas adecuadas de Ritonavir todavía no se determinan. (Lacy, 2011).

Ajuste de dosis en disfunción renal: no se recomienda un ajuste (la depuración renal es insignificante). (Lacy, 2011).

Ajuste de dosis en disfunción hepático:

Disfunción hepática leve o moderada:

No se recomienda ajuste de dosis; se refieren niveles séricos más bajas de Ritonavir en pacientes con disfunción hepática moderada (usar con cautela; vigilar estrechamente en busca de la respuesta adecuada). (Lacy, 2011).

Disfunción hepática grave: usar con cautela; la farmacocinética de

Ritonavir en estos pacientes aún no se estudia. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Ritonavir o a cualquier componente de la formulación, Alfuzosina, Amiodarona, Cisaprida, Dihidroergotamina, Ergonovina, Ergotamina, Flecainida, Lovastatina, Metilergonovina, Midazolam (oral), Pimozida, Propafenona, Quinidina, Sildenafil (cuando se utiliza para el tratamiento de hipertensión pulmonar y arterial) Simvastatina, hierba de San Juan, Triazolam y Voriconazol concurrentes (cuando se toman ≥ 800 mg/día de Ritonavir). (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

El Ritonavir puede inhibir el metabolismo de los siguientes fármacos y causar efectos adversos graves o potencialmente mortales: Alfuzosín, Amiodarona, Astemizol, Bepridil, Cisaprida, Ergonovina, Ergotamina, Flecainida, Midazolam, Pimozida, Propafenona, Quinidina, Terfenadina, Metilergonovina Triazolam y Dihidroergotamina (la administración concurrente de estos fármacos e Indinavir está contraindicada). (Taketomo, 2009).

El Ritonavir incrementa los niveles séricos o los efectos tóxicos de: Meperidina, Warfarina, Desimipramina; Ketoconazol; Claritromicina; Rifabutina y su



metabolito; agentes hipolipemiantes; Sildenafil u otros inhibidores de la enzima 5-fosfodiesterasa (PDE-5) (usar una dosis menor de estos fármacos). El Ritonavir aumenta de modo significativo los niveles séricos de Fluticasona y puede producir efectos corticosteroides sistémicos; la administración concurrente de Ritonavir y Fluticasona no es recomendable a menos que los beneficios sean mayores que los riesgos. El Ritonavir aumenta los niveles séricos de Indinavir y Saquinavir. (Taketomo, 2009).

El Ritonavir puede aumentar los niveles séricos o los efectos adversos de los siguientes medicamentos (usar con cautela; podría ser necesario utilizar una dosis menor de estos fármacos; vigilar los niveles séricos terapéuticos de estos agentes, si se dispone de ellos): Atorvastatina, Bupropión, Buspirona, Carbamacepina, Clonacepam, Cloracepato, Ciclosporina, Diacepam, Digoxina, Diltiacem, Disopiramida, Dexametasona, Dronabinol, Estazolam, Etosuximida, Fluracepam, Itraconazol, Lidocaína, Metanfetamina, Metoprolol, Mexiletina, Nefazodona, Nifedípina, Períenazina, Prednisona, Propoxifeno, Quinina, Risperidona, Sirolimus, Inhibidores Selectivos De La Recaptura de Serotonina, Tacrolimus, Antidrepesivos Tricíclicos, Tioridazina, Timolol, Tramadol, Verapamil, Zolpidem. (Taketomo, 2009).

El Ritonavir disminuye en forma significativa las concentraciones séricas de Teofilina (vigilar los niveles de Teofilina; podría ser necesario aumentar la dosis de ésta); Metadona (podría requerir aumentar la dosis de Metadona); Etinilestradiol, Anticonceptivos Orales o Transdérmicos (usar medidas anticonceptivas adicionales o alternativas). El Ritonavir puede disminuir los niveles de Fenitoína, Ácido Valproico, Lamotrigina, Atovaquona (usar con cautela; puede ser necesario aumentar la dosis de estos fármacos). (Taketomo, 2009).

Las presentaciones de Ritonavir contienen Alcohol y pueden producir una reacción tipo Disulfiram cuando se administran con éste o Metronidazol. El empleo de Ritonavir con Fluoxetina puede dar como resultado síndrome Serotoninérgico. La administración concurrente con Didanosina produce disminución de 13% en el área bajo la curva (ABC) de Didanosina (las dosis de ésta y Ritonavir deben separarse por lo menos 2.5 h). (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Nota: según estudios clínicos pediátricos, el perfil de eventos adversos es similar al de adultos. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: cefalea, confusión. (Taketomo, 2009).



Endocrinas y metabólicas: elevación de triglicéridos y colesterol, elevación de Fosfoquinasa de creatina; raras: hiperglucemia; diabetes; cetoacidosis; redistribución y acumulación de grasa corporal. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, vómito, diarrea, disgeusia, dolor abdominal, anorexia, pancreatitis (Taketomo, 2009).

Hematológicas: raros: episodios de hemorragia espontánea en hemofílicos. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: elevación de enzimas hepáticas, hepatitis (en casos raros puede poner en peligro la vida). (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: parestesias peribucales y periféricas, debilidad. (Taketomo, 2009).

Diversas: reacción alérgica (urticaria, exantema, broncoespasmo, angiedema); síndrome de reconstitución inmunitaria. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Advertencia para estados unidos

El Ritonavir puede interactuar con muchos medicamentos lo que resulta en eventos adversos potencialmente graves o que ponen en peligro la vida. (Taketomo, 2009).

Emplear con cautela en pacientes que toman inhibidores fuertes de CYP3A4; inductores moderados o fuertes de CYP3A4 y sustratos mayores de CYP3A4; considerar agentes alternativos que evitan o disminuyen el potencial de interacciones mediadas por CYP. (Taketomo, 2009).

No se recomienda el uso concomitante con Fluticasona, salmeterol, o dosis elevadas o uso a largo plazo de meperidina. (Taketomo, 2009).

Se ha observado pancreatitis, emplear con cautela en pacientes con triglicéridos aumentados, vigilar lipasa y amilasa en suero y por síntomas gastrointestinales. Se han reportado incrementos en colesterol total y triglicéridos, efectuar vigilancia antes del tratamiento y de manera periódica durante el mismo. (Taketomo, 2009).

Los inhibidores de la proteasa se han asociado con una variedad de eventos de hipersensibilidad (algunos graves), incluidos exantema, anafilaxia (rara), angiedema, broncoespasmo, eritema multiforme y síndrome de Stevens-Johnson (raro). (Taketomo, 2009).

Por lo general se recomienda suspender el tratamiento si aparece exantema grave o síntomas moderados acompañados de otros síntomas generalizados. Usar con cautela en pacientes con miocardiopatía, enfermedad cardíaca isquémica, anomalías de la



conducción preexistentes, enfermedad cardíaca estructural; puede haber aumento del riesgo de anomalías de la conducción (p. ej., bloqueo AV de segundo y tercer grado). (Taketomo, 2009).

El Ritonavir se ha asociado con bloqueo AV debido a la prolongación del intervalo PR; utilizar con cautela con fármacos que prolongan el intervalo PR. (Taketomo, 2009).

Emplear con precaución en pacientes con hemofilia A o B, se han reportado aumentos del sagrado durante el tratamiento con inhibidor de la proteasa se han reportado cambios en la tolerancia a la glucosa, hiperglucemia, exacerbación de la diabetes y diabetes mellitus de nuevo inicio en pacientes que toman inhibidores de la proteasa. Puede estar asociado con la redistribución de grasa (joroba de búfalo, circunferencia abdominal aumentada, ingurgitación de glándulas mamarias, atrofia facial y dislipidemia). (Lacy, 2011).

Puede desarrollarse síndrome de reconstitución inmune que resulta en aparición de una respuesta inflamatoria a una infección de lenta evolución residual oportunista puede requerirse subsecuente evaluación y tratamiento. Puede ocasionar hepatitis o exacerbar la disfunción hepática preexistente, emplear con cautela en pacientes con hepatitis B o C y en enfermedad hepática. (Lacy, 2011).

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp.1478-1480
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp.905 - 1410
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1611



SALBUTAMOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Salbutamol.

FORMA FARMACEUTICA:

Salbutamol Jarabe.
Salbutamol Inhalado.
Salbutamol Tabletas.

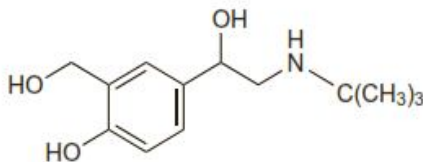
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINÓNIMO:

Sinónimos: Salbutamol, sulfato de albuterol sulfato de salbutamol, albuterol

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente agonista adrenérgico;
Agente agonista adrenérgico beta2;
Antiasmático; Broncodilatador;
simpaticomimético (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Prevención y alivio de broncoespasmo en pacientes con obstrucción reversible de vías respiratorias por asma o enfermedad pulmonar obstructiva crónica (EPOC); prevención de broncoespasmo inducido por ejercicio. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de Acción: Relaja el músculo liso bronquial al actuar en los receptores beta2 con poco efecto en la frecuencia cardíaca. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

Oral:

- **Inicio de acción:** efecto máximo. (Lacy, 2011).
- **oral:** 0.5 a 2 h. (Lacy, 2011).

Inhalado:

- **Albuterol propulsado por CFC:** 10 min. (Lacy, 2011).

Jarabe:

- **Oral:** 2 a 3 horas. (Lacy, 2011).
- **Duración:** 4 a 6 horas. (Lacy, 2011).



- **Metabolismo:** hepático a un sulfato inactivo. (Lacy, 2011).
- **Vida media, eliminación:** oral: 3.7 a 5 horas. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** orina (30% del fármaco sin cambios). (Lacy, 2011).

Nebulización:

- **Inicio de acción:** efecto máximo. (Lacy, 2011).
- **Nebulización/inhalación:** 0.5 2 h. (Lacy, 2011).
- **Albuterol propulsado por CFC:** 10 min. (Lacy, 2011).
- **Duración:** nebulización/inhalación oral 4 a 6 horas. (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático a un sulfato inactivo. (Lacy, 2011).
- **Vida media, eliminación:** inhalación: 3.8 horas. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** orina (30% del fármaco sin cambios). (Lacy, 2011).

DOSIS:

DOSIFICACIÓN USUAL:

Exacerbación de asma aguda

Nebulización:

Niños: 0.15 mg/kg (dosis mínima: 2.5 mg) cada 20 min por tres dosis, luego 0.15 a 0.3 mg/kg (sin exceder 10 mg) cada 1 a 4 h según se requiera, o 0.5 mg/kg/h en infusión continua. (Taketomo, 2009).

Nota: la nebulización continua de 0.3 mg/kg/h de Albuterol se utiliza también con seguridad en el tratamiento del estado asmático grave en niños; las dosis continuas nebulizadas de 3 mg/kg/h + 2.2 mg/kg/h en niños cuya edad promedio era de 20.7 meses no produjeron cardiotoxicidad; la dosis óptima para nebulización continua aún no se determina. (Taketomo, 2009).

Adultos: 2.5 a 5 mg cada 20 min por tres dosis, luego 2.5 a 10 mg cada 1 a 4 h según se requiera o 10 a 15 mg/h en Infusión continua
Inhalación: Inhalador de dosis medida: 90 mcg/atomizador:

Niños: cuatro a ocho disparos cada 20 min por tres dosis, luego cada 1 a 4 h. (Taketomo, 2009).

Adultos: cuatro a ocho disparos cada 20 min hasta 4 h, luego cada 1 a 4 h según se requiera. (Taketomo, 2009).

Terapéutica de mantenimiento (no aguda) (guías de los NIH):

Inhalación: inhalador de dosis medida: 90 mcg/atomizador:

Niños > 4 años y adultos; una o dos inhalaciones cada 4 a 6 h;



máximo 12 inhalaciones/día.
(Taketomo, 2009).

Broncoespasmo inducido por ejercicio: niños > 4 años y adultos: dos inhalaciones 5 a 30 min antes del ejercicio. (Taketomo, 2009).

DOSIFICACIÓN USUAL

Jarabe, como sulfato: 2 mg/5 mL (480 mL)

Niños:
10 a 15 kg: 1.25 mg tres a cuatro veces/día. (Taketomo, 2009).

> 15 kg: 2.5 mg tres a cuatro veces/día. (Taketomo, 2009).

Niños < 12 años: 0.75 a 1.5 mg tres a cuatro veces/día. (Taketomo, 2009).

Niños > 12 años y adultos: 1.5 mg tres a cuatro veces/día. (Taketomo, 2009).

DOSIFICACIÓN USUAL

Exacerbación de asma aguda:

Oral:

Presentación de liberación Inmediata:

Niños 2 a 6 años: 0.1 a 0.2 mg/kg/dosis tres veces/día; dosis máxima sin exceder 4 mg tres veces/día. (Taketomo, 2009).

Niños 6 a 12 años: 2 mg/dosis tres a cuatro veces/día. (Taketomo, 2009).

Niños > 12 años y adultos: 2 a 4 mg/dosis tres a cuatro veces/día. (Taketomo, 2009).

Presentación de liberación sostenida:

Niños: 0.3 a 0.6 mg/kg/día, divididos en dos dosis; no exceder 8 mg/día. (Taketomo, 2009).

Niños > 12 años y adultos: 4 mg dos veces/día; puede aumentarse a 8 mg dos veces/día. (Taketomo, 2009).

Como alternativa:

Niños:
10 a 15 kg: 1.25 mg tres a cuatro veces/día. (Taketomo, 2009).

> 15 kg: 2.5 mg tres a cuatro veces/día. (Taketomo, 2009).

Niños < 12 años: 0.75 a 1.5 mg tres a cuatro veces/día. (Taketomo, 2009).

Niños > 12 años y adultos: 1.5 mg tres a cuatro veces/día. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:
Hipersensibilidad a Albuterol, Aminas Adrenérgicas, o a cualquier componente de la formulación.²

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:



Evitar el uso concomitante de Albuterol con Ibeguano. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Nota: La incidencia de efectos adversos depende de la edad del paciente y de la vía de administración. (Lacy, 2011).

Cardiovasculares: angina, fibrilación auricular, arritmias, malestar torácico, dolor torácico, extrasístoles, rubor, hiper/hipotensión, palpitaciones, taquicardias supra ventricular, taquicardia. (Lacy, 2011).

Sistema nerviosos central: estimulación del SNC, mareo, somnolencia, cefalea, insomnio, irritabilidad, desfallecimiento, migraña, nerviosismo, pesadillas, agitación, crisis convulsivas. (Lacy, 2011).

Dermatológicas: angioedema, exantema, urticaria. (Lacy, 2011).

Endocrinas y metabólicas: hiperglucemia, hipopotasemia, Acidosis Láctica. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales: diarrea, boca seca, dispepsia, gastroenteritis, náusea, sabor inusual, vómito. (Lacy, 2011).

Genitourinarias: dificultad para orinar. (Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: calambres musculares, temblor, debilidad, dolor musculo esquelético. (Lacy, 2011).

Otíco: otitis media, vértigo. (Lacy, 2011).

Respiratorias: exacerbación de asma, broncoespasmo, tos, epistaxis, laringitis, sequedad o irritación orofaríngea, edema orofaríngeo, faringitis, rinitis, inflamación de vías respiratorias superiores, infecciones respiratorias virales. (Lacy, 2011).

Misceláneo: reacción alérgica, anafilaxia, diaforesis, linfadenopatía. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Optimizar el tratamiento con antiinflamatorios antes de comenzar la terapia de mantenimiento con albuterol. No debe utilizarse como componente del tratamiento crónico sin un medicamento antiinflamatorio. (Lacy, 2011).

Solo las formas más leves de asma (etapa 1 y/o inducida por ejercicio) no requerirían su uso concurrente con base en los lineamientos de asma. (Lacy, 2011).

Los pacientes deben instruirse para buscar atención médica en casos en que los síntomas agudos no se alivien o si un nivel previo de respuesta disminuye. La necesidad de incrementar la frecuencia de uso puede indicar deterioro del asma y



el tratamiento no debe retrasarse.
(Lacy, 2011).

Usar con precaución en individuos con enfermedades cardiovasculares (arritmia o hipertensión, o HF).
(Lacy, 2011).

Trastornos convulsivos, diabetes, glaucoma, hipertiroidismo, o hipopotasemia. Los agonistas beta pueden ocasionar elevación de la presión sanguínea, frecuencia cardíaca y producir estimulación/excitación del SNC.
(Lacy, 2011).

Los agonistas beta dos pueden incrementar el riesgo de arritmia, aumentar la glucosa sérica o disminuir el potasio serico. (Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Los efectos clínicos de sobredosis:

Angina, arritmias, mareos, boca seca, fatiga, dolor de cabeza, hiperglucemia, hipertensión o hipotensión, hipocalemia, insomnio, náuseas malestar convulsiones taquicardia con velocidades de hasta 200 latidos por minutos, temblor. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007)..

El tratamiento debe ser sintomático.

Para taquiarritmias, el uso prudente de un cardioselectivo Beta Adrenérgicos, si es necesario, sin embargo, la precaución es necesaria debido a la posible inducción de broncoespasmo por el Betabloqueante. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007)..

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 660.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 68-69.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1131.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 93-94.



SAQUINAVIR

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Mesilato de Saquinavir.

FORMA FARMACEUTICA:

Cápsulas.

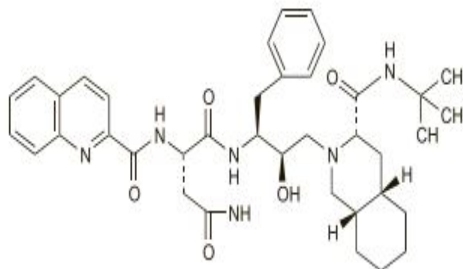
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Mesilato de Saquinavir; (S)-N-[(α S)- α -[(1R)-2-[(3S,4aS,8aS)-3-(terc-Butilcarbamoil)octahidro-2(1H)-isoquinolil]-1-hidroxietil]fenil]-2-quinaldamidosuccinamida.(Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antirretroviral; agentes contra VIH (agentes antiVIH); inhibidor de la proteasa.(Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento de infección por VIH; en combinación con por lo menos otros dos agentes antirretrovirales.(Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: es un inhibidor de la proteasa que actúa sobre un enzima (proteasa) en la fase tardía del proceso de replicación del VIH, después de que el virus penetra en el núcleo celular.(Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:**deficiente; aumentada con alimento rico en grasa.(Lacy, 2011).
- **Distribución:** V_d :700 L; no se distribuye en el CSF.(Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** es de aproximadamente el 98%.(Lacy, 2011).
- **Metabolismo:**ampliamente hepático vía CYP3A4; amplio efecto de primer paso.(Lacy, 2011).



- **Biodisponibilidad:** es de aproximadamente el 4%.(Lacy, 2011).
- **Excreción:** heces (81 a 88%), orina (1 a 3%) en un lapso de 5 días.(Lacy, 2011).

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Dosis usual para adultos y niños mayores de 16 años:

1000 mg (cinco capsulas de 200 mg o dos tabletas de 500 mg) dos veces al día administradas en combinación con Ritonavir 100 mg dos veces al día.(Lacy, 2011).

Administrar esta combinación junta y en un lapso de 2 horas después de una comida completa, en combinación un análogo nucleósido.(Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

hipersensibilidad al Saquinavir o a cualquier componente de la formulación; disfunción hepática grave; coadministración con Amiodarona, Cisaprida, Flecainida, Midazolam, Pimozida, Propafenona, Quinidina, Rifampicina, Triazolam, o derivados de la ergotamina.(Lacy, 2011).

Precauciones:

Ser cauteloso en pacientes con insuficiencia hepática. Se puede

exacerbar la disfunción hepática preexistente, emplear con cautela en pacientes con hepatitis B o C y en cirrosis. Puede asociarse con la redistribución de grasa (joroba de búfalo, aumento de la circunferencia abdominal, congestión mamaria, atrofia facial). Ser cauteloso en hemofilia. Puede incrementar el colesterol, los triglicéridos o ambos. Se han reportado cambios en la tolerancia a la glucosa, hiperglucemia, exacerbación de la diabetes, DKA y nuevo inicio de diabetes mellitus en pacientes que toman inhibidores de la proteasa.(Lacy, 2011).

El uso concurrente de Saquinavir y Ritonavir puede prolongar el intervalo QT_c; evitar administrar a pacientes con antecedentes de QT_c prolongado, miocardiopatía, enfermedad del sistema de conducción, cardiopatía isquémica o estructural, hipopotasiemia no corregida, hipomagnesiemia, o administración concurrente de otros medicamentos que se sabe prolongan el QT o intervalos PR.(Lacy, 2011).

Emplear con cautela en pacientes que toman inhibidores fuertes de CYP3A4, inductores de CYP3A4 moderados o fuertes y sustratos mayores de CYP3A4.(Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Astemizol, Cisaprida, derivados de la ergotamina, Midazolam, Triazolam, Terfenadina: el uso concomitante de Saquinavir con



Terfenadina da como resultado un aumento en las concentraciones plasmáticas de Terfenadina, competencia para la enzima CYP3A del citocromo P450 por Saquinavir también puede inhibir el metabolismo de Astemizol, Cisaprida, derivados de la ergotamina, Midazolam o Triazolam; debido a la posibilidad de arritmias cardíacas graves o potencialmente mortal así como sedación prolongada, el uso concurrente de cualquiera de estos medicamentos con Saquinavir en cápsulas de gelatina blanda, no se recomienda. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Agentes bloqueadores de los canales de calcio, Dapsona, Quinidina: La administración concomitante de cápsulas de Mesilato de Saquinavir con estos medicamentos que son sustratos de la isoenzima CYP3A4 del sistema enzimático citocromo P450, pueden aumentar las concentraciones plasmáticas de estos medicamentos, los pacientes deben ser monitorizados por posibles toxicidades asociadas con estos medicamentos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Carbamazepina, Dexametasona, Fenobarbital, Fenitoína, Rifabutina u otros medicamentos que son inductores metabólicos del sistema enzimático del citocromo P450: La administración concomitante de Rifabutina o Rifapim con cápsulas de Mesilato

de Saquinavir ha resultado en una disminución en el área bajo la curva (AUC) en estado estacionario y la concentración plasmática máxima (C_{max}) de Saquinavir en aproximadamente un 80% y 40%, respectivamente; Carbamazepina, Dexametasona, Fenobarbital, Fenitoína u otros medicamentos que inducen el CYP3A4 también pueden reducir las concentraciones plasmáticas de Saquinavir, el uso de medicamentos alternativos se debe considerar si el paciente está tomando cualquier formulación de Saquinavir. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Claritromicina: el uso concomitante de Saquinavir en cápsulas de gelatina blanda con Claritromicina se ha traducido en un aumento de 177% en el área bajo la curva (AUC) de Saquinavir, un aumento del 45% en el área bajo la curva (AUC) de Claritromicina, y una disminución del 24% del área bajo la curva (AUC) del metabolito activo 14-hidroxiclaritromicina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Delavirdina: el uso concurrente se ha traducido en un aumento de cinco veces en el área bajo la curva (AUC) con cápsulas de Mesilato de Saquinavir; la función hepática deberá controlarse si estos medicamentos se administran simultáneamente. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Indinavir, Nelfinavir, Ritonavir: la administración simultánea de cápsulas de Mesilato de Saquinavir cápsulas blandas de gelatina de Mesilato de Saquinavir con Indinavir se ha traducido en un aumento de 364% en el área bajo la curva (AUC) de Saquinavir; la administración concurrente de cápsulas de Mesilato de Saquinavir o cápsulas de gelatina blanda de Mesilato de Saquinavir con Nelfinavir se ha traducido en un aumento de 392 % en el área bajo la curva (AUC) de Saquinavir y un aumento del 18% en el área bajo la curva(AUC) de Nelfinavir, actualmente no hay datos de seguridad y eficacia del uso de esta combinación.

En pacientes infectados por VIH, la administración concomitante de cápsulas de Mesilato de Saquinavir (400 o 600 mg dos veces al día) con Ritonavir (400 mg o 600 dos veces al día) se ha traducido en valores de área bajo la curva (AUC) de Saquinavir que fueron por lo menos 17 veces mayor que los históricos valores de área bajo la curva (AUC) de Saquinavir en pacientes que recibieron 600 mg tres veces al día sin ritonavir.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

ketoconazol: el uso concomitante de Ketoconazol con Saquinavir ha resultado en estado estacionario, valores de área bajo la curva (AUC) y Cmax para Saquinavir de tres veces los observados con Saquinavir administrado solo, si hay ajuste de la dosis cuando estos dos medicamentos se administran

juntos, la farmacocinética del Ketoconazol no se ven afectada.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Zalcitabina y Zidovudina: la administración simultánea de Saquinavir con Zalcitabina y Zidovudina como terapia triple resultó en ningún cambio en la absorción, metabolismo o eliminación de cualquiera de los medicamentos.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Valores de pruebas de laboratorio:

Alteraciones de los valores en pruebas de laboratorio o valores de pruebas fisiológicas:

Alaninaaminotransferasa, amilasa, aspartatoaminotransferasa, la creatina quinasa, gamma-glutamilttransferasa: valores puede ser aumentado.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Bilirrubina o **potasio:** las concentraciones puede ser aumentadas.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Glucosa: Las concentraciones puede ser disminuidas o aumentadas.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



EFFECTOS ADVERSOS:

Nota: los datos presentados son en base a la formulación de capsulas de gel blando en combinación con ritonavir.

Cardiovasculares: dolor torácico.(Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: fatiga, fiebre, ansiedad, depresión, cefalea, insomnio, dolor.(Lacy, 2011).

Gastrointestinales: nausea, diarrea, vómito, dolor abdominal, estreñimiento, molestia abdominal, apetito disminuido, ulceración de la mucosa bucal, dispepsia, flatulencia, alteración del gusto.(Lacy, 2011).

Endocrinas y metabólicas: lipodistrofia, hiperglucemia, hipoglucemia, hiperpotasiemia, trastorno de la libido, amilasa en suero aumentada.(Lacy, 2011).

Dermatológicas: prurito, exantema, labios/piel seca, erupción, verruga.(Lacy, 2011).

Hepáticas: AST aumentada, ALT aumentada, bilirrubina aumentada.(Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: dolor de espalda, CPK aumentada, parestesia, debilidad.(Lacy, 2011).

Renal: creatinincinasa aumentada.(Lacy, 2011).

Respiratorias: neumonía, bronquitis, sinusitis.(Lacy, 2011).

Misceláneo: influenza.(Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **B.**(Taketomo, 2009)
- Lactancia: se desconoce si se excreta en la leche materna por lo tanto está contraindicado.(Taketomo, 2009)
- Administrar en un lapso de 2 horas después del alimento.(Taketomo, 2009)

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación: En un paciente que ingirió una dosis única de 8 gramos de cápsulas de mesilato de saquinavir no fueron observados síntomas de una toxicidad aguda; se indujo emesis en un lapso de tiempo de 2 a 4 horas después de la ingestión. No hay efectos tóxicos graves registrados en un paciente que ingirió 7200 mg por día durante 25 semanas en un estudio fase II.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento para la intoxicación:

Para más información en el manejo de sobredosis o ingestión



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



accidental, llame a un centro de control de envenenamiento.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2674-2676.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp.Pp. 1508-1509.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: PharmaceuticalPress. Pp. 906-907.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1133-1135.



SECNIDAZOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Secnidazol.

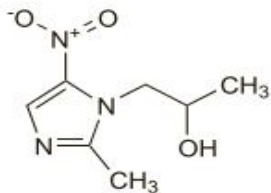
FORMA FARMACEUTICA:

Comprimido recubierto.

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Es un derivado sintético de los 5-nitroimidazoles de vida media larga (dentro de los cuales está también el Metronidazol y el Tinidazol).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Se indican en presencia de una Amebiasis intestinal, Amebiasis hepática, Giardiasis y Trichomoniasis vaginal. Derivado sintético de la serie de los nitroimidazoles.

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

La acción del Secnidazol determinada in vitro es mediante la degradación de ADN e inhibición de la síntesis de ácidos nucleicos, efectivo durante la mitosis o sin ella. Debido a su absorción lenta puede permanecer más tiempo en la luz intestinal y realiza su acción in situ contra parásitos intestinales como giardia y Ameba.

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** El Secnidazol es completamente absorbido después de la administración oral.
- **Distribución:** tiene una buena distribución a todo el Organismo, inclusive atraviesa la barrera placentaria y se excreta en la leche materna.
- **Unión a proteínas:** se une en un 15% a las proteínas plasmáticas. (Martindale, 2009).
- **Metabolismo:** El metabolismo es probablemente en el hígado dando como resultado derivados hidroxilos y ácidos.



- **Excreción:** La eliminación esencialmente es urinaria y lenta por lo que pacientes con amebiasis y giardiasis tienen una respuesta de curación con 2 g (30 mg/kg en niños) en un solo día. La vida media de eliminación en sangre es de pasado 28 horas y en Plasma de 30 horas.

DOSIS:

DOSIS ORAL

Amebiasis intestinal:

Amebiasis aguda sintomática (forma histolítica):

Adulto: 2g en una administración única al comienzo de la comida.

Niños: 30 mg/kg/día en una administración única. La dosis se toma solo un día.

Amebiasis asintomática (forma quística):

La misma dosis diaria durante 3 días.

Amebiasis hepática:

Adultos: 1,5 g/día en 1 o varias administraciones al comienzo de la comida durante 5 días.

Niños: 30mg/ kg/ día en 1 o varias administraciones al comienzo de la comida durante 5 días.

Giardiasis y trichomoniasis:

En adultos y niños mayores de 12 años 4 tabletas (2g) dosis única o

puede administrarse 2 tabletas cada 12 horas.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: Hipersensibilidad a los derivados del Secnidazol. De igual forma está contraindicada durante el primer trimestre del embarazo, también en sujetos con antecedentes de discrasia sanguínea y enfermedades del Sistema Nervioso Central (SNC).¹

Precauciones: ya que contiene Tartrazina, la cual puede producir reacciones alérgicas incluyendo asma bronquial en personas susceptibles. Evitar tomar bebidas y medicamentos que contienen alcohol pues puede provocar calor, enrojecimiento, vómitos, taquicardia. Puede interferir con la determinación de sangre en enzimas hepáticas.

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Disulfiram: pues puede producir confusión, delirio.

Anticoagulantes orales (warfarina): Aumenta el efecto de estos anticoagulantes y de riesgo de hemorragia por disminución del metabolismo hepático. Controlar el tiempo de protrombina. Adaptar la posología a los anticoagulantes orales durante el tratamiento y días después de finalizado.

Litio: En asociación con Litio puede ocasionar toxicidad por Litio.



Fenobarbital: Administración con fenobarbital aparentemente disminuye la vida media sérica del Secnidazol.

EFFECTOS ADVERSOS:

Gastrointestinales: náuseas, gastralgias, modificación del gusto (sabor metálico), glositis, estomatitis. (Martindale, 2009).

Endocrinas y metabólicas: Leucopenia.

Dermatológicas: urticaria.

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Lactancia: pasa a la leche materna.

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación: Cuando existe una sobredosificación, los síntomas que se han reportado son: náuseas, vómitos y ataxia.

Tratamiento para la intoxicación:

El tratamiento consiste en las mismas medidas usuales de soporte.

REFERENCIAS:

1. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 846-847.



SELEGILINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Selegilina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

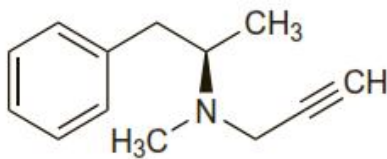
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Hidrocloruro de (R)-(-), N,alfa-dimetil-N-2-propinilfenetilamina.(Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antidicsinetico.(Martindale, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

La Selegilina está indicada para su uso con Levodopa o combinación de Levodopa y Carbidopa en el tratamiento de la enfermedad idiopática de Parkinson (parálisis

agitante).(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Algunos estudios han sugerido que el uso inicial de la Selegilina puede retrasar la necesidad de adición de Levodopa para el régimen de tratamiento, además, estos estudios han mostrado que la Selegilina solo o en combinación con Levodopa puede retardar la progresión de la enfermedad de Parkinson, posiblemente mediante prevención selectiva de la destrucción de neuronas Dopaminérgicas en la sustancia negra.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Un estudio retrospectivo mostró que la Selegilina posiblemente prolonga la duración de la vida de los pacientes con enfermedad de Parkinson idiopática.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La adición de la Selegilina a la Levodopa en pacientes que experimentan respuestas fluctuantes (deterioro de fin, el efecto o fenómeno on-off) puede ser de beneficio moderado.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Sin embargo, la respuesta inicial a la Selegilina no puede ser sostenido, con el grado de mejora disminuyendo a lo largo de 6 meses a 4 años, la Selegilina es ineficaz en la enfermedad avanzada con



fluctuaciones extremas.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Fluctuaciones motoras de control puede ser debido a factores de efectos de la Dopamina que puede fallar en algunos casos para mejorar este problema.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

La acción de la Selegilina se cree que está relacionado con la inhibición irreversible en el cerebro humano de MAO B, (MAO B), la forma mayor de la Aminación enzimática de la Dopamina en el cerebro, se inhibe cuando la Selegilina se une covalentemente y estequiométricamente a la Isoalloxaine Flavina Adenina Dinucleotida (FAD) en su centro activo.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La administración de 10 mg de Selegilina en un día produce casi completa inhibición de la MAO-B en el cerebro.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La Selegilina se convierte en un inhibidor no selectivo de toda la monoamino oxidasa (MAO) a dosis

más altas, posiblemente de 20 a 40 mg al día.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La Selegilina (o sus metabolitos) también pueden actuar a través de otro mecanismo para aumentar la actividad Dopaminérgica, incluyendo la interferencia con la recaptación de Dopamina en la sinapsis.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** Se absorbe rápidamente desde el tracto gastrointestinal.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Distribución:** Cruza la barrera sangre-cerebro.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Biotransformación:** Se metaboliza rápida y completamente a N-desmetildeprenil, 1-metanfetamina, y a anfetamina.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **La vida media:** La vida media de los 3 metabolitos activos que



se encuentran en el suero y la orina después de una sola dosis de Selegilina son las siguientes
N-desmetildeprenil: 2 horas. 1-anfetamina: 17,7 horas.

1-metanfetamina: 20,5 horas.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

- **Eliminación:** La Selegilina: 39 (rango, 16 a 69) horas.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Tiempo para alcanzar la concentración plasmática:** 0,5 a 2 horas.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Duración de la acción:** Duración de la acción clínica depende del tiempo de regeneración de la MAO B.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Eliminación:** Renal: lento, 45% de una dosis de 10 mg aparece en la orina como metabolitos (N-desmetilprenil, 1-anfetamina, y metanfetamina, dentro de las 48 horas de la ingestión.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Tabletas:

Niños y adolescentes: TDAH (uso no autorizado): 5 a 15 mg/día. (Lacy, 2011)

Adultos: enfermedad de Parkinson: 5 mg dos veces al día con el desayuno y comida o 10 mg en la mañana. (Lacy, 2011)

Adultos mayores: enfermedad de Parkinson: inicial: 5 mg en la mañana, puede aumentarse a un total de 10 mg/día. (Lacy, 2011)

Tabletas de desintegración oral:

adultos: enfermedad de Parkinson: inicial: 1.25 mg diarios por lo menos durante 6 semanas: puede aumentar a 2.5 mg diarios basándose en la respuesta clínica (máximo 2.5 mg diarios). (Lacy, 2011)

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Selegilina o a cualquier componente de la fórmula, uso concomitante de meperidina. (Lacy, 2011)



Tabletas de desintegración oral:

Contraindicaciones adicionales:

uso concomitante de Dextrometorfano, Metadona, Propoxifeno, Tramadol, Selegilina oral, otros Inhibidores de la MAO. (Lacy, 2011)

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante de la Selegilina con cualquiera de los siguientes: Agonistas Alfa/Beta (acción indirecta), Agonistas Alfa1, Agonistas Alfa2 (oftálmicos), Anfetaminas; Opioides de Anlidopiperidina; Atomoxentina, Bupropion; Buspirona; Carbamazepina; Linezolid; Maprotilina, Meperidina, Metildopa, Metilfenidato, Mirtazapina, Propoxifeno, Inhibidores selectivos de la recaptura de Serotonina, agonistas de los receptores 5-HT_{1D} de Serotonina, moduladores de Serotonina, inhibidores de la recaptura de Serotonina /Norepinefrina, Tetrahidrozolina, y Antidepresivos Tricíclicos. (Lacy, 2011)

EFFECTOS ADVERSOS:

Reportados:

<1% o frecuencia no definida:

Pruebas de funcionamiento hepático alteradas, aumento de Fosfatasa Alcalina, aumento de apetito, arritmia, asma, ataxia, fibrilación auricular, infección bacteriana, cambios en la conducta/estado de ánimo, bilirrubinemia, bradicardia, bradicinesia, neoplasia mamaria, dolor mamario, corea, parestesias circunmorales, colitis, deshidratación, depresión, despersonalización, labilidad emocional, epistaxis, eructos, euforia, edema facial, fiebre, infección por hongos, gastritis, espasmo generalizado, glositis, golpe de calor, hematuria, hernia, hostilidad, hipercolesterolemia. (Lacy, 2011)

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

La inhibición de la MAO-B no debe presentar ningún problema con los productos que contienen Tiramina mientras se usen las dosis típicas orales, de cualquier manera, se han reportado reacciones raras. Se presenta mayor riesgo de inhibición de la MAO no selectiva con las dosis en capsulas de más de 10 mg/día o dosis en tabletas de desintegración oral mayores de 2.5 mg/día. (Lacy, 2011)



INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Para reducir la absorción:

La inducción de la emesis o lavado gástrico con las vías respiratorias protegidas seguida de la administración de una suspensión de carbón activado en sobredosis temprana.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

El tratamiento específico:

El tratamiento de signos y síntomas del sistema nervioso central (SNC) para estimulación con Diazepam, administrado por vía intravenosa y lentamente, derivados de Fenotiazina debe ser evitado.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

El tratamiento de la hipotensión y el colapso vascular con agentes intravenosos puede producir una respuesta marcadamente aumentado.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento vigoroso de hipertermia con antipiréticos y una manta de enfriamiento.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Monitoreo:

Seguimiento de la temperatura de cuerpo.(Drug Information for the

Health Care Professional USP DI, 2007).

La atención de apoyo:

Mantenimiento del equilibrio de líquidos y electrolitos.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Apoyo de la respiración por la dirección de la vía aérea y la ventilación mecánica con el uso de oxígeno suplementario, según sea necesario.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Pacientes en quienes se confirma o sospecha de sobredosis intencional deben ser referidos a consulta psiquiátrica.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

- (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2677-2678
- Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1513
- Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 817

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenett.com

www.cegimed.org

SERTRALINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Sertralina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

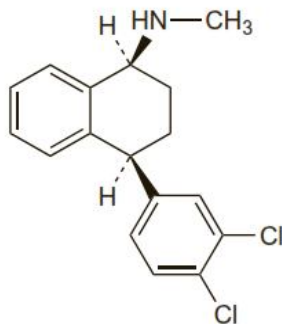
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Hidrocloruro de (1S,4S)-4-(3,4-diclorofenil)-1,2,3,4-tetrahidro-N-metil-1-naftilamina. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antidepresivo inhibidor selectivo de la recaptura de serotonina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento de depresión mayor, trastorno obsesivo-compulsivo, trastorno de pánico (con o sin agorafobia), trastorno de estrés postraumático, trastorno disfórico premenstrual, trastorno de ansiedad social. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

Antidepresivo con efectos inhibidores selectivos sobre la recapture presináptica de Serotonina y solo efectos muy débiles sobre la recapture neuronal de Norepinefrina y Dopamina. (Lacy, 2011).

Los estudios in viro demuestran una afinidad no significativa por los receptores Adrenérgicos, Colinérgicos, GABA, Dopaminérgicos, Histaminérgicos Serotonérgicos o para Benzodiacepinas. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Unión a proteínas:** 98%. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Metabolismo:** efecto de primer paso significativo; experimenta



N-desmetilización en N-desmetilsertralina (mucho menos activa que la Sertralina); tanto la molécula madre como el metabolito experimentan desaminación oxidativa, seguida de reducción, Hidroxilación y Glucuronidación. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: los niños de 6 a 17 años metabolizan la Sertralina un poco mejor que los adultos, y sus ABC y concentraciones máximas son 22% más bajas que en adultos cuando se ajustaron según el peso; sin embargo, se recomiendan dosis menores para pacientes pediátricos más pequeños, a fin de evitar niveles excesivos del medicamento. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

- **Biodisponibilidad:** aproximadamente igual para tabletas que para solución oral. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Vida media:** molécula madre: promedio: 26 h; metabolito (N-desmetilsertralina): 62 a 104 h. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Niños: 6 a 12 años: promedio: 26.2 h

Niños: 13 a 17 años: promedio: 27.8 h. (Drug Information for the

Health Care Professional USP DI, 2007).

- **Adultos:** 18 a 45 años: promedio: 27.2 h. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Eliminación:** 40 a 45% de la dosis se elimina en la orina (nada como fármaco sin cambios); 40 a 45% se elimina en las heces (12 a 14% como fármaco no modificado). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Depuración:** puede disminuir en pacientes con disfunción hepática. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Diálisis: es probable que no elimine una cantidad importante del medicamento debido a su Vd grande. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS:

Niños de 6 a 12 años:

Depresión:

Nota: no está aprobada por la FDA; véase Advertencias; inicial: 12.5 a 25 mg una vez al día; ajustar la dosis en forma ascendente si es clínicamente necesario; pueden aumentarse 25 a 50 mg/día a intervalos de por lo menos una semana; la dosis final promedio en 21 niños (8 a 18 años) fue de 100 +



53 mg o 1.6 mg/kg/día ($n = 11$); intervalo: 25 a 200 mg/día; dosis máxima: 200 mg/día; evitar dosis excesivas. (Taketomo, 2009).

Trastorno obsesivo-compulsivo:

inicial: 25 mg una vez al día; ajustar la dosis en forma ascendente si es clínicamente necesario; pueden aumentarse 25 a 50 mg a intervalos de por lo menos una semana; intervalo: 25 a 200 mg/día; dosis máxima: 200 mg/día; evitar dosis excesivas. (Taketomo, 2009).

Adolescentes de 13 a 17 años:

Depresión:

inicial: 25 a 50 mg una vez al día; ajustar la dosis en forma ascendente si es clínicamente necesario; pueden aumentarse 50 mg a intervalos de por lo menos una semana; la dosis final promedio en 13 adolescentes fue de 110 + 50 mg o cerca de 2 mg/kg/día; en otro estudio que utilizó un ajuste más lento, la dosis promedio en la semana 6 fue de 93 mg ($n = 41$) y en la semana 10 fue de 127 mg ($n = 34$); intervalo: 25 a 200 mg/día; dosis máxima: 200 mg (Taketomo, 2009).

Trastorno obsesivo-compulsivo:

inicial:

50 mg una vez al día; ajustar la dosis en forma ascendente si es clínicamente necesario; pueden aumentarse 50 mg a intervalos de por lo menos una semana; intervalo:

25 a 200 mg/día; dosis máxima: 200 mg/día. (Taketomo, 2009).

Adultos:

Depresión y trastorno obsesivo-compulsivo: inicial: 50 mg una vez al día; ajustar la dosis en forma ascendente si es clínicamente necesario; pueden aumentarse 50 mg a intervalos de por lo menos una semana; intervalo: 50 a 200 mg/día; dosis máxima: 200 mg/día. (Taketomo, 2009).

Trastornos de pánico, de estrés postraumático y de ansiedad social: inicial:

25 mg una vez al día; aumentar la dosis luego de una semana a 50 mg una vez al día; ajustar la dosis en forma ascendente si es clínicamente necesario; aumentar 50 mg/día a intervalos de por lo menos una semana; intervalo: 50 a 200 mg/día; dosis máxima: 200 mg/día. (Taketomo, 2009).

Trastorno disfórico premenstrual: inicial:

50 mg/día administrados a diario durante todo el ciclo menstrual o sólo durante la fase lútea del ciclo menstrual (con base en la valoración del médico); pueden aumentarse si es necesario 50 mg por ciclo menstrual; dosis máxima cuando se administra a diario durante todo el ciclo: 150 mg/día; dosis máxima cuando se administra sólo durante la fase lútea del ciclo: 100 mg/día. (Taketomo, 2009).



Nota: si se utiliza una dosis de 100 mg/día en la fase lútea, usar una velocidad de ajuste de 50 mg/día durante los primeros tres días (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Sertralina o cualquier componente la formula, uso de inhibidores de la MAO en 14 días cercanos, uso concurrente de Pimozida, uso concurrente del concentrado oral de Sertralina con Disulfiram. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Efectos del metabolismo/transporte sustrato de CYP2B6 (menor), 2C9 (mayor), 2D6 (mayor), 3A4 (menor). (Lacy, 2011).

Evitar uso concomitante de la Sertralina con cualquiera de los siguientes: Clopidogrel, Disulfiram, Everolimus, lobenguan 123; inhibidores de la MAO, Metoclopramida, Pimozida, Siburamina, Tioridazina, Tolvaptan. (Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Exámenes de laboratorio:

Alanina Aminotrasnferasa (ALT [SGPT]) o Aspartato Aminotrasnferasa (AST [SGOT]), valores se incrementan 3 veces

sobre el limite normal son reportados frecuentemente, el incremento usualmente ocurre con 1 o 9 semanas de iniciar la terapia, con los valores generalmente normalizados después del uso Sertralina son discontinuados. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central: agitación, mareo, cefalea, insomnio, nerviosismo, fatiga, somnolencia, fiebre, dificultad para concentrarse, activación de manía o hipomanía, labilidad emocional, reacción agresiva, pensamiento anormal, convulsiones, hipercinesia; ideación y conducta suicidas. (Taketomo, 2009).

Nota: la activación de la conducta relacionada con ISRS (es decir, inquietud, hipercinesia, hiperactividad, agitación) es dos o tres veces más común en niños en comparación con adolescentes; es más común en adolescentes que en adultos. (Taketomo, 2009).

La somnolencia (que incluye sedación y sopor) es más frecuente en adultos en comparación con niños y adolescentes. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: exantema. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: pérdida ponderal, SIADH,



hiponatremia (pacientes con agotamiento de volumen), disminución del Ácido Úrico sérico, disfunción sexual, disminución de la libido; también se informa ganancia pondera. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, vómito, diarrea, heces blandas, xerostomía, constipación, anorexia, dispepsia. (Taketomo, 2009).

Nota: el vómito vinculado con ISRS es dos a tres veces más común en niños en comparación con adolescentes; es más prevalente en adolescentes que en adultos. (Taketomo, 2009).

Genitourinarias: incontinencia Urinaria Hematológicas: disfunción plaquetaria, púrpura. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: temblor, parestesias, hipercinesia, contracciones musculares, malestar general. (Taketomo, 2009).

Oculares: visión anormal. (Taketomo, 2009).

Respiratorias: epistaxis Diversas: diaforesis; síntomas de abstinencia tras la suspensión abrupta. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Su seguridad y eficacia en pacientes pediátricos > 6 años sólo está establecida para el tratamiento de trastorno obsesivo compulsivo; la Sertralina no está aprobada para el

tratamiento de depresión en pacientes pediátricos. Niños y adultos con trastorno depresivo mayor pueden experimentar agravamiento clínico de la depresión, o ideación o conducta suicidas. (Taketomo, 2009).

En estudios clínicos los Antidepresivos aumentaron el riesgo de ideación y conducta suicidas, en niños, adolescentes y adultos jóvenes (18 a 24 años) con trastorno de depresión mayor y otras alteraciones psiquiátricas. (Taketomo, 2009).

Debe considerarse este riesgo antes de prescribir Antidepresivos para cualquier indicación clínica. (Taketomo, 2009).

Los estudios a corto plazo no mostraron aumento en el riesgo de tendencias suicidas con el uso de Antidepresivos en pacientes > 24 años y mostraron una disminución del riesgo en pacientes > 65 años. (Taketomo, 2009).

Los pacientes de todas las edades tratados con Antidepresivos por cualquier indicación requieren vigilancia estrecha en busca de agravamiento clínico de la depresión, tendencia suicida y cambios de conducta inusuales, en especial durante los primeros meses del inicio del Antidepresivo o cuando se ajusta la dosis. Los familiares y cuidadores deben recibir instrucciones para que observen de cerca al paciente (es decir, todos los días) y comunicar su



condición al médico. (Taketomo, 2009).

Los pacientes deben vigilarse en busca de conductas relacionadas (p. ej., ansiedad, agitación, ataques de pánico, insomnio, irritabilidad, hostilidad, agresividad, impulsividad, acatasia, hipomanía, manía), que pueden incrementar el riesgo de agravamiento de la depresión y tendencia suicida. (Taketomo, 2009).

El agravamiento de la depresión o el surgimiento de tendencia suicida (o las conductas relacionadas que se mencionaron antes) de manera abrupta, graves o que no son parte de los síntomas de presentación, podrían requerir la suspensión o modificación de la terapéutica farmacológica. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

La Sertralina tiene amplio margen de seguridad en caso de sobredosis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Sin embargo, las muertes se han producido en las sobredosis relacionados con Sertralina en combinación con otras drogas y / o alcohol. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Los síntomas de sobredosis se asemejan a los efectos colaterales adversos que ocurren con dosis

terapéuticas, pero puede ser más intensa o varios síntomas pueden ocurrir juntos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Los efectos siguientes han sido seleccionados sobre la base de su potencial o importancia clínica:

Posibles signos y síntomas escalofríos, temblores, diarrea falta de coordinación, y/o fiebre. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

El tratamiento de la sobredosis:

No existe un antídoto específico para la Sertralina. El tratamiento es sintomático y de apoyo esencialmente. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para disminuir la absorción:

Administrar carbón activado, cosa que puede ser usado con sorbitol, puede ser tan efectivo o más efectivo que el vómito o lavado gástrico. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Monitorear funciones cardíacas y los signos vitales. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Cuidados de apoyo: mantenga despejadas las vías respiratorias. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Pacientes en los que se haya confirmado o se sospecha sobredosis intencional deben ser referidos a consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp.2677-2685.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1518-1519.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 421.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp.



SUBSALICILATO DE BISMUTO

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Subsalicilato de bismuto.

FORMA FARMACEUTICA:

Suspensión oral.
Tabletas masticables.

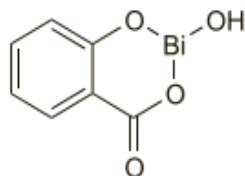
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Bismatrol; Bismuto rosa;
Subsalicilato de bismuto.(Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antidiarréico.(Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento sintomático de diarrea leve e inespecífica; control de la diarrea del viajero; como parte de un régimen multifármaco para la erradicación de *H. pylori* para

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

reducir el riesgo de recurrencia de úlcera duodenal.(Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

Su mecanismo antidiarreico no ha sido bien determinado pero el Subsalsalicylate de Bismuto puede estimular la absorción de fluidos y electrólitos a través de la pared intestinal (acción antisecretora) y también cuando es hidrolizado a Ácido Salicílico inhibiendo la síntesis de prostaglandinas responsables de la inflamación intestinal y la hipermotilidad.

Adicionalmente el Subsalsalicylate de Bismuto enlaza las toxinas producidas por *E. coli*. Ambos, Subsalsalicylate de Bismuto y los productos de reacción intestinal, Oxidocloruro de Bismuto e Hidróxido de Bismuto son aprobados para tener acción bactericida.

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** después de la administración oral, el Subsalsalicylate de Bismuto es casi completamente hidrolizado en el tracto gastrointestinal a Bismuto y Ácido Salicílico. (Lacy, 2011).

- **Distribución:** el Bismuto absorbido se distribuye por todo el cuerpo.(Lacy, 2011).

www.cegimed.org



- **Unión a proteínas:** el Bismuto tiene una unión a proteínas mayor al 90%. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** el Bismuto es excretado principalmente en la orina y la bilis, el aclaramiento renal es de 50 más o menos 18 mL por minuto. (Lacy, 2011).

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Tratamiento de diarrea inespecífica, control/alivio de la diarrea del viajero: (dosis basada en 262 mg/15 mL líquido o 262 mg tabletas).

Dosis para niños mayores de 12 años y adultos:

2 tabletas o 30 mL cada 30 minutos a 1 hora según se requiera, hasta 8 dosis en 24 horas. (Lacy, 2011)

Eradicación de *Helicobacter pylori*:

Dosis adultos:

524 mg 4 veces al día con comidas y al acostarse; requiere terapia combinada. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: es posible que sea mejor evitarlo en pacientes con insuficiencia renal. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Anticoagulantes derivados de la Cumarina o Indandiona, Heparina, y agentes trombolíticos como Alteplase, Estreptoquinasa, Uroquinasa: porque pueden aumentar el riesgo de sangrado.

Salicilato: puede aumentar los efectos hipoglucémicos de agentes antidiabéticos orales o Insulina.

El uso simultáneo de otros salicilatos puede incrementar el riesgo de toxicidad.

Probenecid o Sulfinpirazona: pueden disminuir su efecto por dosis de salicilatos. El Probenecid puede disminuir el aclaramiento renal e incrementar las concentraciones plasmáticas y toxicidad de salicilatos.

Tetraciclinas: orales, el contenido de Carbonato de Calcio en las tabletas pueden disminuir la absorción gastrointestinal y la biodisponibilidad de Tetraciclinas los pacientes deben evitar ingerir tabletas de Subsalicilato dentro de una a 3 horas después de ingerida la Tetraciclina oral.

EFFECTOS ADVERSOS:

Misceláneo: El Subsalicilato de Bismuto puede convertirse en el tracto gastrointestinal en Sulfito de Bismuto, causando un oscurecimiento temporal de la lengua y de las evacuaciones. (Lacy, 2011).



ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C/D** (3er trimestre).(Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación:

Encefalopatías de Bismuto: ansiedad, confusión, dificultad para hablar, severo y/o continuado dolor de cabeza, depresión mental, espasmos musculares especialmente de la cara, mandíbula, temblores y movimientos incontrolables.

Síntomas de salicilismo: pérdida de oído, confusión, diarreas continuas, vértigos, zumbido de oídos, somnolencia severa, respiración rápida o profunda; dolor de cabeza severo o continuo; sudoración; incremento de la sed; náusea o vómito severo o continuo; dolor de estómago, severo o continuo; movimientos incontrolables de las manos, especialmente en ancianos; problemas de la visión.

Tratamiento para la intoxicación:

El tratamiento recomendado para la sobredosis puede incluir:

- Para disminuir la absorción: vaciar el estómago vía inducción de la

emesis o lavado gástrico; administrando carbón activado.

- Para engrandecer la eliminación: la institución de transfusión por cambio externo, hemodiálisis, diálisis peritoneal, o hemoperfusión como se requiera en sobredosis severa.

- Tratamiento específico la monitorización de la concentración sérica de los salicilatos hasta una disminución de la concentración hasta el rango no tóxico. La concentración de los salicilatos de 500 mcg/mL 2 horas después de la ingestión indica seria toxicidad; las concentraciones de salicilatos por encima de 8000 mcg/mL 2 horas después de la ingestión indica posible fatalidad. En adición, la monitorización prolongada puede ser necesaria en un caso de sobredosis masivo porque la absorción puede ser retrasada.

- Incluyendo la diuresis alcalina forzada para incrementar la excreción de los salicilatos. Sin embargo, el bicarbonato no debe ser administrado oralmente para este propósito porque la absorción de los salicilatos puede ser incrementada. También si se utiliza Acetazolamida, el riesgo incrementado de acidosis metabólica y toxicidad por salicilatos debe ser considerado. Es recomendado que



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Acetazolamidasea administrada concurrentemente con una solución alcalina intravenosa. La administración de sangre o Vitamina K1 si fuera necesaria para tratar hemorragias.

- Monitorización y soporte de las funciones vitales; monitorización para edema pulmonar y convulsiones e institución de una terapia apropiada si fuera necesaria.
- El cuidado de soporte corrección de la hipertermia; fluidos, electrolitos y un desequilibrio ácido-base; cetosis; y concentraciones de glucosa en plasma como sea necesario.
- Los pacientes en quienes la sobredosis es confirmada o sospechada se referirá a consulta siquiátrica.

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp.Pp. 219-220.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1711.



SUCCINATO DE DOXILAMINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Succinato de Doxilamina.

FORMA FARMACEUTICA:

Suspensión oral.

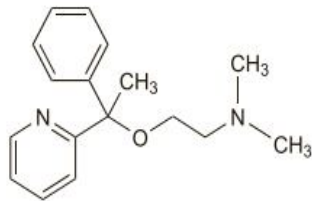
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Doxilaminasuccinato; Succinato de 2-[α -(2-dimetilaminoetoxi)- α -metilbencil]piridina.(Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antihistamínico H1.(Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

El Succinato de Doxilamina, un derivado de la monoetanolamina, es un antihistamínico sedante con

notables efectos antimuscarínicos y sedantes.

El Succinato de Doxilamina se administra por vía oral para el alivio sintomático de reacciones de hipersensibilidad, trastornos cutáneos pruriginosos, como hipnótico en el tratamiento a corto plazo del insomnio.(Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: antihistamínicos utilizados en el tratamiento de la alergia, actúan por competición con la histamina por los sitios de los receptores H1 sobre las células efectoras. Que por lo tanto previenen, pero no invierten, la respuesta mediada por la histamina sola. Los antihistamínicos antagonizan, en diversos grados, la mayoría de los efectos farmacológicos de la histamina, incluyendo urticaria y prurito.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

FARMACOCINÉTICA:

- **Concentración plasmática máxima:** se alcanza al cabo de 2 a 3 horas.(Taketomo, 2009).
- **Vida media:** semivida de eliminación: aproximadamente 10 horas.(Taketomo, 2009).



DOSIS:

DOSIS ORAL:

Se administran dosis de Succinato de Doxilamina de hasta 25 mg cada 4 a 6 horas, hasta un máximo de 150 mg/día. La dosis habitual como hipnótico es de 25 mg administrados por la noche.(Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:excepto en circunstancias especiales, este medicamento no debe ser usado cuando se presenten problemas médicos como el siguiente: insuficiencia hepática.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Precauciones: puede causar somnolencia, debe de evitarse el consumo de bebidas alcohólicas al momento de estar utilizando este medicamento.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Puede disminuir la respuesta emética a la apomorfina.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: igual que antihistamínicos sedantes en general.

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Valores de pruebas de laboratorio:

En casos de sobredosificación se ha asociado con un aumento de creatinina en plasma y mioglobinuria.(Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central:depresión del sistema nervioso central, con efectos que van desde una ligera somnolencia a un profundo sueño, lasitud, vértigo y descoordinación.(Taketomo, 2009).

Gastrointestinales:nausea, vómitos, diarrea, dolor epigástrico, estreñimiento y aumento del reflujo gástrico.(Taketomo, 2009).

Renal:dificultad o retención urinaria.(Taketomo, 2009).

Respiratorias:secreciones espesas del aparato respiratorio.(Taketomo, 2009).

Misceláneo:sequedad bucal, visión borrosa, cefalea.(Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo:**B**.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



- De preferencia no utilizarse, ya que existe cierta controversia en cuanto al uso de este medicamento durante el embarazo.(Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Los síntomas más frecuentes en una sobredosificación esta la disminución de la conciencia, también se han observado comportamientos psicóticos, convulsiones y síntomas antimuscarínicos como taquicardia y midriasis.(Taketomo, 2009).

Tratamiento para la intoxicación:

Ya que no existe un antídoto específico para la sobredosis con antihistamínicos, el tratamiento es sintomático y de apoyo.

Para disminuir la absorción: la inducción de la emesis (jarabe de ipecacuana recomendado), sin embargo, tener mucha precaución contra la aspiración, especialmente en los lactantes y los niños.

Para mejorar la eliminación: catárticos salinos (leche de magnesia) se utiliza a veces.

Tratamiento

específico: vasopresores para tratar la hipotensión, sin embargo, la epinefrina no deben utilizarse ya que además puede reducir la

presión arterial. Oxígeno y líquidos intravenosos.

Nota: para más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, llame a un centro de control de envenenamiento.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 349-364.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 578.



SUCCINATO SÓDICO DE CLORANFENICOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Succinato Sódico de Cloranfenicol.

FORMA FARMACEUTICA:

Polvo para uso parenteral.

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antibiótico bacteriostático.
(Martindale, 2009).

INDICACIONES:

Es un antibiótico bacteriostático con un amplio espectro de acción contra bacterias Gram-positivas y bacterias Gram-negativas, así como algunos otros organismos.(Martindale, 2009).

Se utiliza extensamente en el tratamiento tópico del oído y, en particular, en las infecciones oculares, a pesar del hecho de que muchas de estas son leves y remiten espontáneamente. También se utiliza tópicamente en el tratamiento de las infecciones de la piel.(Martindale, 2009).

Cuando la administración oral de cloranfenicol no es factible, se puede utilizar Succinato Sódico de Cloranfenicol, soluble en agua, por vía intravenosa, pero debe sustituirse por el tratamiento por vía

oral lo antes posible.(Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:Cloranfenicol se cree que entrar en las células sensibles por un proceso de transporte activo. Dentro de la célula se une a la subunidad 50S del ribosoma de las bacterias en un sitio adyacente al sitio de acción de los macrólidos y Clindamicina, e inhibe en las bacterias la síntesis de proteínas impidiendo la unión de aminoacilARN de transferencia a su sitio aceptor sobre el ribosoma, evitando así la formación del enlace peptídico peptidiltransferasa.(Martindale, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:**se absorbe fácilmente cuando se administra por vía oral.(Martindale, 2009).
- **Distribución:**se distribuye ampliamente en los tejidos y líquidos corporales; entra en el LCR, donde se alcanzan concentraciones de aproximadamente el 50% de las existencias en la sangre.(Martindale, 2009).



- **Concentración sanguínea**

máxima: concentraciones

sanguíneas de 10 microgramos/mL o superiores se alcanzan aproximadamente en 1 a 2 horas tras una dosis única de 1 g por vía oral, y se han descrito concentraciones plasmáticas de aproximadamente 18.5 microgramos/mL tras dosis múltiples de 1 g. (Martindale, 2009).

- **Metabolismo:** el Succinato Sódico, que se administra por vía parenteral, probablemente se hidroliza a fármaco libre principalmente en el hígado, los pulmones y los riñones; esta hidrólisis puede ser incompleta en lactantes y recién nacidos. (Martindale, 2009).

- **Unión a proteínas:** hasta aproximadamente el 60% del fármaco circulante se une a las proteínas plasmáticas. (Martindale, 2009).

- **Vida media:** oscila entre 1.5 a 4 horas. (Martindale, 2009).

- **Excreción:** se excreta principalmente por la orina, pero solo del 5 al 10% de una dosis oral aparece inalterada; alrededor del 3% se excreta por la bilis. Sin embargo, la mayoría es reabsorbido y sólo aproximadamente el 1%, principalmente en la forma inactiva, se excreta por las heces. (Martindale, 2009).

DOSIS:

Las dosis se expresan en términos de la base y son similares tanto si se administra por vía oral como por vía intravenosa.

La dosis habitual para adultos y niños: es de 50 mg/Kg/día divididos en tomas cada 6 horas; se pueden administrar hasta 100 mg/Kg/día en caso de meningitis o en infecciones graves causadas por microorganismos moderadamente resistentes, aunque las dosis altas deben reducirse lo antes posible. (Martindale, 2009).

En el tratamiento de las infecciones oculares:

el cloranfenicol se aplica normalmente en forma de solución al 0.5% o como pomada al 1%. (Martindale, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

El Cloranfenicol está contraindicado en pacientes con un historial de hipersensibilidad o reacción tóxica al fármaco. Nunca debe administrarse sistémicamente para infecciones menores para la profilaxis. Los cursos repetidos y prolongados del tratamiento deben evitarse y no deberíaser utilizado en pacientes con pre-existente de depresión de médula ósea o discrasias sanguíneas. Periódicos exámenes de sangre de son aconsejables en todos los pacientes,



El uso de Cloranfenicol con otros fármacos que puedan deprimir la función de la médula ósea debe ser evitado.(Martindale, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Dicumarol y Warfarina: el Cloranfenicol puede potenciar los efectos de los anticoagulantes cumarínicos.(Martindale, 2009).

Clorpropamida, Tolbutamina: el cloranfenicol puede potenciar el efectos de algunos hipoglucemiantes tales como los que se mencionan, esto es debido a que el cloranfenicol es inactivado en el hígado y puede interactuar con fármacos que se metabolizan en el hígado por enzimas hepáticas microsomales, así como en el caso de antiepilépticos como la fenitoína.(Martindale, 2009).

Fenobarbital, Rifampicina: el metabolismo del cloranfenicol se puede aumentar por inductores de las enzimas hepáticas como en el caso de estos dos medicamentos.(Martindale, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central:confusión, delirium, depresión, fiebre, cefalea.(Lacy, 2011).

Gastrointestinales: diarrea, enterocolitis, glositis, náusea, estomatitis, vómito.(Lacy, 2011).

Dermatológicas:angioedema, exantema, urticaria. (Lacy, 2011).

Hematológicas: anemia aplásica, supresión de la médula ósea, granulocitopenia, anemia hipoplásica, pancitopenia, trombocitopenia.(Lacy, 2011).

Oculares: neuritis óptica.(Lacy, 2011).

Misceláneo: anafilaxia, reacciones de hipersensibilidad, síndrome gris.(Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C/D** (3er trimestre).(Lacy, 2011).
- El Cloranfenicol puede disminuir los efectos del hierro y Vitamina B12 en pacientes anémicos y de vez en cuando afecta la acción de los anticonceptivos orales. (Martindale, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Tratamiento para la intoxicación:

Se comprobó que la hemoperfusión a través de carbón vegetal era muy superior a una exanguinotransfusión para extraer el cloranfenicol de la sangre, aunque no evitaba la muerte en niños de 7 semanas con el síndrome gris, en los cuales ha



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos

CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



existido un error en la dosis.(Martindale, 2009).

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp.Pp. 385-387.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 240-242.



SUCCINILCOLINA CLORURO

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Succinilcolina.

FORMA FARMACEUTICA:

Solución inyectable.

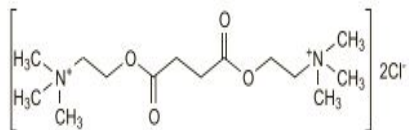
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

2,2'-succinildioxibis(etiltrimetilamonio) diclorurohidratado; cloruro de succinilcolina; cloruro de suxametonio. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente bloqueador neuromuscular despolarizante.(Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Para facilitar la secuencia rápida y la intubación endotraqueal de rutina y para relajar los músculos esqueléticos durante la cirugía; para reducir la intensidad de las

contracciones musculares de las convulsiones inducidas por medio eléctrico o farmacológico.(Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: actúa de manera similar a la acetilcolina, produce despolarización de la placa terminal motora en la unión mioneural, la cual ocasiona parálisis musculoesquelética flácida sostenida por un estado de acomodación que se desarrolla en las membranas musculares excitables adyacentes.(Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Inicio de acción:**
IM: 2 a 3 minutos
IV: relajación muscular completa 30 a 60 segundos.(Lacy, 2011).
- **Duración:**
IM: 10 a 30 minutos.
IV: 4 a 6 minutos con administración única.(Lacy, 2011).
- **Metabolismo:**hidrolizada con rapidez por la pseudocolinesterasa plasmática.(Lacy, 2011).
- **Excreción:**orina.(Lacy, 2011).



DOSIS:

Nota: dosis para efecto; la dosis variará debido a la variabilidad interpaciente; emplear el peso corporal ideal para pacientes obesos.(Lacy, 2011).

DOSIS IM: Niños y adultos: hasta 3-4 mg/Kg, la dosis total no debe exceder de 150 mg.(Lacy, 2011).

DOSIS IV: Para niños:

Nota: debido al riesgo de hipertermia maligna, no se recomienda la administración continua en lactantes y niños.

Niños más pequeños: intermitente: inicial: 2 mg/Kg/dosis una vez.
Mantenimiento: 0.3-0.6 mg/Kg/dosis cada 5-10 minutos según sea necesario.(Lacy, 2011).

Niños mayores y adolescentes: intermitente: inicial: 1 mg/Kg/dosis una vez.
Mantenimiento: 0.3-0.6 mg/Kg cada 5-10 minutos según sea necesario.(Lacy, 2011).

Dosis usual para adultos:

Inicial:

Procedimientos quirúrgicos

breves:

0.6 mg/Kg (rango 0.3-1.1 mg/Kg).(Lacy, 2011).

Procedimientos quirúrgicos prolongados:

Infusión continua: 2.5-4.3 mg/min; ajustar la dosis con base a la respuesta.

Intermitente: inicial: 0.3-1.1 mg/Kg.

Mantenimiento: 0.04-0.07 mg/Kg/dosis como se requiera.(Lacy, 2011).

Nota: aumentar la dosis inicial de Succinilcolina cuando se emplea un agente no despolarizante antes del tratamiento debido al antagonismo entre la Succinilcolina y agentes bloqueadores neuromusculares no despolarizantes.(Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: la Succinilcolina está contraindicada en pacientes con miopatías del músculo esquelético. Además, la Succinilcolina no se debe utilizar en pacientes con lesiones graves, quemadura, traumatismo grave, denervación extensa de músculo esquelético, o lesión neuronal superior. El uso de Succinilcolina en estos pacientes puede dar lugar a peligrosa hiperpotasemia, el paro cardíaco se ha producido cuando se usó Succinilcolina en pacientes con estas condiciones.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Precauciones: Se requiere precaución en pacientes con deterioro de la función cardiovascular.

Los efectos pueden prolongarse en



pacientes con deterioro de la función renal, pero en menor medida que para galamina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

También se requiere precaución en condiciones que pueden llevar a una baja actividad en el plasma de pseudocolinesterasa (anemia severa, deshidratación, exposición a insecticidas neurotóxicos u otros inhibidores de colinesterasa, enfermedad hepática grave o cirrosis, desnutrición, embarazo, rasgo hereditario recesivo).

Condiciones que pueden ser afectados adversamente por aumento de la presión intraocular (glaucoma, cirugía ocular). Al igual que debe tenerse precaución en personas que presentan fracturas o espasmos musculares, hipertermia maligna en la historia del paciente o en un familiar cercano. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Analgésicos opioides: puede aumentar la incidencia y la gravedad de bradicardia e hipotensión cuando se utilizan en conjunto con Cloruro de Succinilcolina. También, la liberación de histamina puede ser aditiva a la inducida por muchos opioides. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Anestésicos inhalatorios

hidrocarbonados: al utilizarse de manera conjunta con Cloruro de Succinilcolina se produce una potenciación del efecto de los anestésicos inhalatorios hidrocarbonados menos que para los agentes bloqueadores neuromusculares no despolarizantes. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Inhibidores de la colinesterasa: al utilizarse de manera simultánea con cloruro de Succinilcolina puede prolongar en su efecto. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Glucósidos digitálicos: la combinación de cloruro de Succinilcolina con estos medicamentos puede causar arritmias cardíacas u otros efectos adversos a nivel cardíaco. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento crónico con litio:

pacientes que reciben este tratamiento puede que mejoren o prolonguen el efecto. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Metotrimoprazina: efectos

secundarios graves con el uso concurrente de han sido reportados. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Fisostigmina: efectos aditivos con fisostigmina se han reportado. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Professional USP DI, 2007).

Medicamentos que agotan el potasio: el efecto del Cloruro de Succinilcolina puede ser potenciado. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Valores de pruebas de laboratorio:

La concentración sérica de potasio puede verse aumentada con el consumo de Succinilcolina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La producción de dióxido de carbono y el consumo de oxígeno se puede aumentar de forma transitoria. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: arritmias, bradicardia (más marcada con la segunda dosis, más frecuente en niños), paro cardíaco, hiper/hipotensión, taquicardia. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales: salivación (excesiva). (Lacy, 2011).

Endocrinas y metabólicas: hiperpotasemia. (Lacy, 2011).

Dermatológicas: exantema. (Lacy, 2011).

Ocular: presión intraocular aumentada. (Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: rigidez mandibular, fasciculación muscular, dolor muscular posoperatorio, rabdomiólisis (con posible insuficiencia renal aguda mioglobinúrica). (Lacy, 2011).

Renal: insuficiencia renal aguda (secundaria a rabdomiólisis). (Lacy, 2011).

Respiratorias: apnea, depresión respiratoria (prolongada). (Lacy, 2011).

Misceláneo: anafilaxia, hipertermia maligna. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C**. (Lacy, 2011).
- Lactancia: se desconoce si se excreta en la leche materna/usar con cautela. (Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación: la acción de bloqueo neuromuscular del Cloruro de succinilcolina es terminada por la enzimasplasmática colinesterasa y puede ocurrir apnea



prolongada en pacientes con una enzima atípica o con una enzima de baja actividad. También puede ocurrir taquifilaxia con dosis repetidas. (Martindale, 2009).

Tratamiento para la intoxicación:

Una vez administrado Cloruro de Succinilcolina debe mantenerse respiración asistida hasta que la respiración espontánea se ha restaurado completamente. La transfusión de nuevo plasma congelado u otra fuente de la colinesterasa plasmática ayudará a la destrucción de la Succinilcolina cuando la parálisis es prolongada resultado de suero atípico o bajas concentraciones de colinesterasa plasmática. (Martindale, 2009).

Las reacciones graves de hipersensibilidad deben ser tratadas inmediatamente con medidas de soporte.

Los efectos muscarínicos de Cloruro de Succinilcolina, tales como bradicardia y la secreción de saliva excesiva, se pueden reducir dando un antimuscarínico tal como atropina antes de Succinilcolina. Una pequeña dosis de un bloqueador neuromuscular competitivo dado antes de Succinilcolinase ha utilizado para reducir algunos de los efectos adversos del Suxametonio en los músculos. (Martindale, 2009).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2180.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp. Pp. 1557-1558.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1909-1912.

SUCRALFATO

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Sucralfato.

FORMA FARMACEUTICA:

Suspensión Oral.

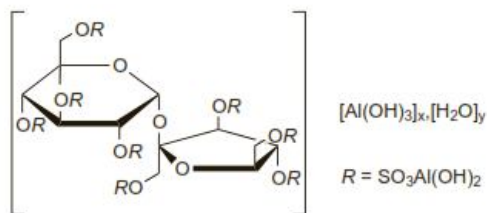
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Complejo con aluminio de 8-D-Fructofuranosil-a-D-glucopiranosido Octaquis hidrogeno sulfato). (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente gastrointestinal para el tratamiento de ulcera gástrica o duodenal. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento a corto plazo de ulceras duodenales ulcera gástrica, la suspensión puede utilizarse por vía tópica para tratar estomatitis secundaria a quimioterapia contra cáncer u otra erosiones esofágicas gástricas y rectales: terapéutica para el daño mucosos ocasionado por agentes antiinflamatorios no esteroideos, prevención de ulceras por estrés. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de Acción: En presencia de pH ácido (ácido gástrico), la Sal Aluminica de Sacarosa Sulfatada forma una sustancia compleja pastosa que se adhiere a la zona lesionada de la mucosa. Esto produce una cubierta protectora que evita que la mucosa sea dañada por Acido Péptico, Pepsina y Sales biliares. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** oral: <5%. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** no se metaboliza. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** 90% se excreta en heces; las cantidades pequeñas



que se absorben se excretan en la orina sin cambios. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

ORAL

Niños: (uso no autorizado) se ha empleado una dosis de 40-80 mg/kg/día dividida cada 6 horas. (Lacy, 2011)

Estomatitis (uso no autorizado): 5-10 mL (1 g/10 mL suspensión), haga buches y escupa o haga buches y proceda a deglutir cuatro veces/día. (Lacy, 2011)

Adultos: ulcera por estrés (uso no autorizado):

Profilaxis: 1 g 4 veces /día con el estomago vacío y a la hora de dormir durante 4-8 semanas, o de manera alternativa 2 g dos veces al día; se recomienda el tratamiento durante 4-8 semanas en adultos. (Lacy, 2011)

Mantenimiento: profilaxis: 1 g dos veces al día. (Lacy, 2011)

Estomatitis (uso no autorizado): 10 mL (1g/10mL suspensión), haga buches y escupa o haga buches y deglutir cuatro veces/día. (Lacy, 2011)

Ajuste de la dosis en disfunción renal la sal de aluminio se absorbe muy poco ($\leq 5\%$) sin embargo puede acumularse en insuficiencia renal. (Lacy, 2011)

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad al sucralfato o cualquier componente de la fórmula.

Precauciones: Utilizar con cautela en insuficiencia renal, a causa de acumulación de aluminio (Taketomo, 2009)..

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Puede disminuir los niveles y efectos de: Antimicóticos (Azoles Sistémicos), Digoxina, Eltrombopag; Levotiroxina, complemento de Fosfato, Quinidina, Quinolonas, Tetraciclinas, Antagonistas de Vitamina K. (Taketomo, 2009).

Interfiere con la absorción de Vitaminas A, D, E y K. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: edema facial. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: mareo somnolencia, vértigo cefalea. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: exantema, prurito angioedema. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: constipación, diarrea, náusea, malestar gástrico, indigestión, xerostomía, flatulencia. (Taketomo, 2009).



Neuromusculares y esqueléticas:
dorsalgia (Taketomo, 2009).

Respiratorias: laringoespasma,
rinitis, dificultad respiratoria.
(Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Advertencias por la posibilidad de que sucralfato modifique la absorción de algunos medicamentos, espaciar la administración (dar otros medicamentos 2 h antes o después del Sucralfato) cuando se piense que las alteraciones de la biodisponibilidad son importantes. (Taketomo, 2009).

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1560
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1772-1773.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1159.



SULFACETAMIDA SODICA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Sulfacetamida Sódica.

FORMA FARMACEUTICA:

Solución Oftálmica.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

N-[(p-aminofenil) sulfonil] acetamida. (Martindale, 2009).

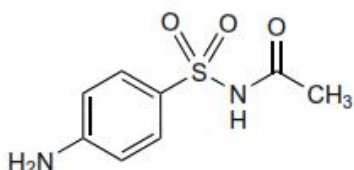
Sinónimos:

Sulamid; Sulfacetamida Sódica. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antibiótico Oftálmico (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento y profilaxis de conjuntivitis debido a organismos susceptibles; úlceras de la cornea, tratamiento auxiliar con Sulfonamidas sistémicas para terapia del tracoma. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: La Sulfacetamida interfiere con la proliferación bacteriana al inhibir la síntesis de Acido Fólico para las bacterias, a través de antagonismo competitivo con PABA. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Distribución:** se excreta en la leche materna. (Taketomo, 2009).
- **Vida media:** 7 a 13 h. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** cuando se absorbe se excreta sobre todo en la orina, como fármaco sin modificar. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Niños: ≥ 2 meses y adultos:



Oftálmica: solución: aplicar 1-2 gotas todos los días, cada 2-3 h en el saco inferior de la conjuntiva a la hora de despertarse y con menos frecuencia en la noche: incrementar el intervalo de la dosis según respondan los padecimientos. (Lacy, 2011).

Duración usual del tratamiento: 7 a 10 día. (Lacy, 2011).

Tracoma: aplicar 2 gotas en el saco de la conjuntiva cada 2 h; emplear en conjunción con la terapia sistémica. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Sulfacetamida, cualquier componente de la fórmula o Sulfonamidas; lactantes < 2 meses; Queratitis epitelial por herpes simple, vaccinia, varicela y otras enfermedades virales de cornea y conjuntiva; micosis de estructuras oculares. (Taketomo, 2009).

Precauciones:

Utilizar con cautela en individuos con xeroftalmia intensa o deficiencia de G6PD. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante a: BCG metenamina, procaína. (Taketomo, 2009).

Incremento del efecto y la toxicidad:

Puede aumentar los niveles y efectos de: Metotrexate, Fenitoína Antagonistas de la Vitamina K. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central: cefalea, fiebre. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: síndrome de Stevens-Johnson, dermatitis exfoliativa, necrólisis epidérmica tóxica, exantema, fotosensibilidad, eritema, prurito, descamación. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: supresión de médula ósea. (Taketomo, 2009).

Locales: irritación, sensación punzante, ardor (sobre todo con la solución al 30%), prurito. (Taketomo, 2009).

Oculares: visión borrosa, queratitis epitelial transitoria, hiperemia reactiva, edema conjuntival. (Taketomo, 2009).

Diversas: reacciones de hipersensibilidad, síndrome semejante a lupus eritematoso. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Su actividad antibacteriana puede disminuir en presencia de exudados purulentos que contienen Ácido Paraaminobenzoico (PABA): los



microorganismos resistentes, como los hongos, pueden proliferar con el uso prolongado o repetido de preparaciones de Sulfonamidas; puede ocurrir hemolisis en pacientes con deficiencia de deshidrogenasa de glucosa-6-fosfato (G6PD). (Taketomo, 2009).

Es posible que se presenten reacciones de hipersensibilidad cuando se readministra una Sulfonamida, independientemente de la vía de administración. (Taketomo, 2009).

Se informa síndrome de Stevens-Johnson después del empleo de Sulfacetamida tópica. Al primer signo de hipersensibilidad, exantema y otras reacciones, informar al médico y suspender su uso. (Taketomo, 2009).

Algunos productos contienen Sulfitos, que pueden causar reacciones alérgicas en individuos susceptibles. (Taketomo, 2009).

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp.1561
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 335.

4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1159-1162.



SULFADIAZINA DE PLATA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Sulfadiazina De Plata.

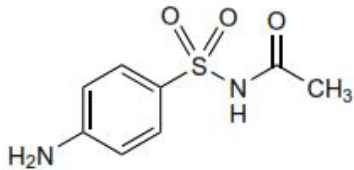
FORMA FARMACEUTICA:

Crema tópica.

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antibiótico Tópico. (Taketomo, 2009)

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Adyuvante para la prevención y tratamiento de infecciones en quemaduras de segundo y tercer grados. (Taketomo, 2009)

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de Acción: Actúa sobre la pared y membranas celulares bacterianas. (Taketomo, 2009)

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** puede ocurrir absorción percutánea importante de sulfadiazina, en especial cuando se aplica a quemaduras amplias. (Taketomo, 2009)
- **Vida media:** 10 horas, se prolonga en pacientes con insuficiencia renal. (Taketomo, 2009)
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** 3 a 11 días de terapéutica tópica continua. (Taketomo, 2009)
- **Eliminación:** aproximadamente 50% se excreta sin cambios en la orina. (Taketomo, 2009)

DOSIS:

NIÑOS Y ADULTOS:

Tópica: aplicar una o dos veces al día con una mano con guante estéril, aplicar una capa de aproximadamente 4mm; el área quemada debe estar cubierta con



crema en todo momento.
(Taketomo, 2009)

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Sulfadiazina Argentica o cualquier componente de la formula; neonatos prematuros o de termino y lactantes < 2 meses, porque las Sulfas pueden desplazar la Bilirrubina de sus sitios de unión a proteínas y causar Kérnicterus.
(Taketomo, 2009)

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar sus usos concomitantes a: BCG. (Taketomo, 2009)

EFFECTOS ADVERSOS:

Dermatológicas: prurito, exantema, eritema multiforme, discromía.
(Taketomo, 2009)

Hematológicas: anemia hemolítica, leucopenia, agranulocitosis, anemia aplasica, trombocitopenia.
(Taketomo, 2009)

Hepáticas: hepatitis. (Taketomo, 2009)

Locales: dolor, ardor. (Taketomo, 2009)

Renales: nefritis intersticial.
(Taketomo, 2009)

Diversas: hiperosmolaridad sérica (debida al componente de

Propilenglicol en crema), reacciones de hipersensibilidad a Sulfas.
(Taketomo, 2009)

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Usar con cautela con pacientes con deficiencia de G6PD y disfunción renal; la Sulfadiazina puede acumularse en pacientes con disfunción renal o hepática.
(Taketomo, 2009)

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp.1976
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1164



SULFATO FERROSO

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Sulfato Ferroso.

FORMA FARMACEUTICA:

Suspensión.
Tabletas.

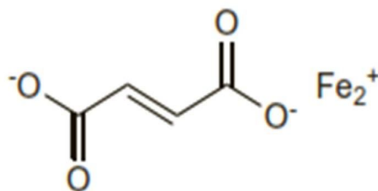
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

FeSO₄ (Sulfato Ferroso); Fumarato Ferroso; Gluconato Ferroso; Sulfato de Hierro (Sulfato Ferroso). (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Mineral oral; Sal de hierro. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martin Dale 2009

INDICACIONES:

Prevención y tratamiento de anemia ferropriva; terapéutica complementarla para pacientes que reciben eritropoyetina alfa. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

El Hierro se libera del plasma y por último restituye los depósitos de hierro agotados en la médula ósea, donde se incorpora a la hemoglobina. (Taketomo, 2009).

Inicio de acción: la respuesta hematológica a las sales de Hierro orales o parenterales es esencialmente la misma; la forma y el color de los eritrocitos cambian en el transcurso de 3 a 10 días. (Taketomo, 2009).

Efecto máximo: la reticulocitosis máxima ocurre en 5 a 10 días y los valores de hemoglobina aumentan en el transcurso de dos a cuatro semanas. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** oral: se absorbe en duodeno y yeyuno superior; en personas con depósitos normales



de Hierro se absorbe 10% de una dosis oral; ello se incrementa a 20 ó 30% en pacientes con depósitos de Hierro inadecuados; el alimento disminuyen su absorción. (Taketomo, 2009).

- **Eliminación:** el Hierro se une en gran parte a la transferrina sérica y se excreta por orina, sudor, detritos de mucosa intestinal y en la menstruación. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Dosificación usual Nota: existen múltiples formulaciones de sales de Hierro; es necesario vigilar muy de cerca la sal cuando se prescribe y administra Hierro; la selección o sustitución incorrecta de una sal por otra sin el ajuste apropiado de la dosis puede ocasionar sobredosificación; oral (la dosis se expresa en miligramos de hierro elemental). (Taketomo, 2009).

RDA de Hierro (dosis expresada como Hierro elemental)

Edad	RDA (mg)
< 5 meses	5
5 meses a 10 años	10
Hombres	
11 a 18 años	12
➤ 18 años	10
Mujeres	
11 a 50 años	15
➤ 50 años	10

Fuente: (Taketomo, 2009).

Tratamiento y profilaxis de deficiencia de Hierro:

-Neonato prematuros: 2 a 4 mg/kg/día o fraccionados cada 12 h (dosis máxima: 15 mg/día). (Taketomo, 2009).

Lactantes y niños:

Anemia ferropriva grave: 4 a 6 mg/kg/día en tres fracciones.
 Anemia ferropriva leve o moderada: 3 mg/kg/día en una o dos fracciones
 Profilaxis: 1 a 2 mg/kg/día, hasta un máximo de 15 mg/día. (Taketomo, 2009).

Adultos:

Deficiencia de Hierro: 2 a 3 mg/kg/día, 60 a 100 mg dos veces al día hasta 60 mg cuatro veces/día, o 50 mg (liberación prolongada) una o dos veces/día.
 Profilaxis: 60 a 100 mg/día. (Taketomo, 2009).

Vía de Administración: Oral

Jarabe: la dosis recomendada es de 15 a 25 ml al día (equivalente a 120-200 mg de Hierro elemental). (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a las sales de Hierro o cualquier componente de la fórmula; hemocromatosis, anemia hemolítica. (Taketomo, 2009).

Precauciones: Evitar administrar por más de seis meses, excepto en pacientes con alteraciones que



requieren tratamiento prolongado; no usar en pacientes con úlcera péptica, enteritis o colitis ulcerosa; evitar en individuos que reciben transfusiones sanguíneas frecuentes. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

La absorción del preparado oral de Hierro y Tetraciclinas disminuye cuando estos dos fármacos se administran juntos; la administración concurrente de antiácidos y Cimetidina puede reducir la absorción de Hierro; es posible que el Hierro disminuya la absorción de Penicilina, Levotiroxina, Metildopa y Levodopa cuando se administran al mismo tiempo. La respuesta al tratamiento con Hierro suele retardarse en pacientes que reciben Cloranfenicol; la administración concurrente de > 200 mg de Vitamina C por 30 mg de Hierro elemental aumenta la absorción oral de Hierro; la absorción de quinolonas puede disminuir por la formación de un complejo de ion férrico-quinolona. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Gastrointestinales: irritación gastrointestinal, dolor epigástrico, náusea, diarrea, heces oscuras, constipación. (Taketomo, 2009).

Genitourinarias: coloración de la orina (negra u oscura). (Taketomo, 2009).

Diversas: los preparados líquidos pueden teñir temporalmente los dientes. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **A**. (Lacy, 2011).
- **Interacción con alimentos**
Leche, cereales, fibra de la dieta, té, café o huevos disminuyen la absorción de hierro. (Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALITICAS:

Prueba de guayaco para sangre en heces positiva falsa. (Taketomo, 2009).

INTOXICACION Y SU TRATAMIENTO:

Dosis Tóxica > 60 mg/kg¹.

Síntomas:

Corroe y erosiona la mucosa GI, aumenta la permeabilidad capilar, puede provocar hipovolemia, coagulopatías (daño hepático) y Insuficiencias (hepática, renal, SNC). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento de sobredosis.

Reducir niveles de Fe. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Tratamiento en Emergencia.

Establecer vías periféricas de inmediato. Si hay síntomas, sospechar shock hipovolémico.

Lavado gástrico: Si la contaminación fue hace 1-2 horas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2548-2549.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1169.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1168-1169.

SUMATRIPTÁN

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Sumatriptán.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas recubiertas simples.

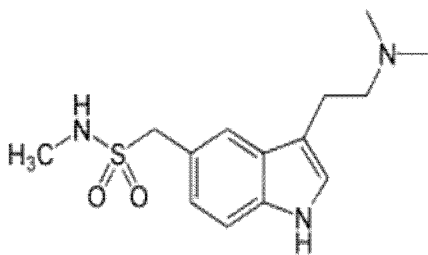
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Succinato de Sumatriptán. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente Antimigrañoso; Agonista del receptor de serotonina 5-HT 1B, 1D. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Inyección, Intranasal y Tabletas: tratamiento agudo de migraña con o sin aura. (Lacy, 2011).

Inyección: tratamiento agudo de cefalea en racimos. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: El Sumatriptán es un agonista selectivo del receptor de serotonina (5-HT₁) en arterias craneales; produce vasoconstricción y reduce la Inflamación estéril vinculada con transmisión neuronal antidrómica, lo cual se correlaciona con alivio de la migraña. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Inicio de acción: oral:** aproximadamente 30 min; Nasal: aproximadamente 15-30 min; Subcutánea: aproximadamente 10 min. (Lacy, 2011).
- **Distribución: adultos:** Vd (central): 50 L; Vd (aparente): 2.4 L/kg. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** 14 a 21%. (Lacy, 2011).



- **Metabolismo:** en el hígado, en un metabolito indolacético (inactivo) que sufre conjugación con áster glucurónico; puede ser metabolizado por la MAO. (Lacy, 2011).
- **Biodisponibilidad:**
Oral: aproximadamente 15%; puede aumentar mucho en enfermedad hepática Intranasal; 17% (en comparación con SC) SC: 97%.(Lacy, 2011).
- **Vida media:**
Distribución; 15 min
Terminal: 2 h; intervalo: 1 a 4 h. (Lacy, 2011).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:**
Oral: adultos sanos: 2 h; durante ataques de migraña: 2.5 h.
SC: intervalo: 5 a 20 min: promedio: 12 min. (Lacy, 2011).
- **Eliminación:** 60% de una dosis oral se excreta por vía renal (sobre todo como metabolitos), 40% se elimina en las heces y sólo 3% como fármaco sin cambios; 42% de una dosis intranasal se excreta como el metabolito Acido Indolacético; 3% se excreta sin cambios en la orina; 22% de una dosis SC se excreta sin cambios en la orina y 38% como metabolito ácido indolacético. (Lacy, 2011).

DOSIS:

Niños y adolescentes: < 18 años: no se recomienda su empleo. (Lacy, 2011).

Adultos:

Oral: dosis inicial única: 25 mg administrados tan pronto como sea posible después del inicio de un ataque de migraña; intervalo: 25 a 100 mg/dosis; la dosis máxima individual es de 100 mg; puede repetirse después de 2 h; dosificación máxima: 200 mg/día. (Lacy, 2011).

Los resultados obtenidos de ensayos clínicos muestran que la dosis inicial de 50 a 100 mg es más efectiva que la dosis de 25 mg, que la dosis de 100 mg no proporciona mayor efecto que la de 50 mg y puede incrementar la incidencia de efectos colaterales. Sin embargo, se han estudiado las dosis de hasta de 300 mg/día; la dosis diaria total no debe exceder de 200 mg. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad al Sumatriptán o cualquier componente de la fórmula; administración IV (puede presentarse vasoespasmo coronario); cardiopatía isquémica, angina de Prinzmetal, síndromes cerebrovasculares o vasculares periféricos (p. ej., apoplejía, ataque isquémico transitorio, enteropatía isquémica); disfunción hepática grave, pacientes con signos o síntomas de cardiopatía isquémica,



infarto miocárdico, infarto miocárdico asintomático, hipertensión no controlada; uso concomitante de derivados de la ergotamina (en las últimas 24 h). (Taketomo, 2009).

Precauciones: Pueden ocurrir aumentos temporales de la resistencia vascular periférica y la presión arterial; usar con cautela en pacientes con alteración de la función hepática o renal, antecedente de convulsiones o trastornos relacionados con disminución del umbral convulsivo; es posible la hipersensibilidad cruzada con sulfonamidas; deben descartarse otros trastornos neurológicos potencialmente graves antes del tratamiento de migraña aguda: el Sumatriptán (administrado cinco veces la dosis máxima oral) ocasionó opacificación corneal en perros; otros estudios en animales sugieren que puede unirse a la melanina del ojo; no se dispone de estudios en humanos. (Taketomo, 2009).

Se refieren efectos adversos graves, como IM, accidente vascular cerebral, pérdida de la visión y muerte en pacientes pediátricos después de la administración de Sumatriptán por vía oral, intranasal o SC; en la actualidad no puede determinarse la frecuencia de tales efectos adversos, de ahí que el uso de Sumatriptán en pacientes < 18 años no es recomendable. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

El empleo de Sumatriptán con medicamentos que contienen Ergotamina puede ocasionar reacciones de vasoespasmo prolongado; medicamentos vasoconstrictores; inhibidores de la MAO (aumentan en grado importante los niveles de Sumatriptán en suero); inhibidores selectivos de la recaptura de serotonina (pueden ocasionar debilidad, pérdida de la coordinación, hiperreflexia; vigilar con cuidado a los pacientes). (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Tableta:
1 a 10%

Cardiovasculares:
dolor/opresión/pesantez/presión torácica (1 a 2%), hiper/hipotensión (1%), síncope (1%). (Lacy, 2011).

Sistema nervioso central:
sensación urente (1%), desvanecimiento (\geq 1%), somnolencia (\geq 1%), malestar general/fatiga (2 a 3 %), cefalea (\geq 1%), dolor inespecífico (1 a 2%), placebo 1%), vértigo (\leq 1 a 2%), migraña, somnolencia. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales: diarrea, náusea, vómito, hiposalivación. (Lacy, 2011).

Genitourinarias: hematuria. (Lacy, 2011).



Hematológicas: anemia hemolítica.
(Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: dolor/opresión/presión en cuello, garganta y mandíbula, parestesia, mialgia, entumecimiento. (Lacy, 2011).

Óticas: hemorragia ótica, pérdida de la audición, sensibilidad al ruido, acúfenos. (Lacy, 2011).

Respiratorias: rinitis alérgica, disnea, inflamación nasal, hemorragia nasal/faríngea, sinusitis, inflamación de las vías respiratorias superiores. (Lacy, 2011).

Misceláneo: reacciones de hipersensibilidad, presión/opresión/pesantez inespecíficas, placebo, sensación de calor/frío. (Lacy, 2011).

2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1570-1572.

3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1174.

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **C** (Lacy, 2011).
- Interacción con Alimentos: El alimento retarda un poco su velocidad pero no su grado de su absorción oral. (Taketomo, 2009).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2548-2549.



TACROLIMUS

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Tacrolimus.

FORMA FARMACEUTICA:

Cápsulas.

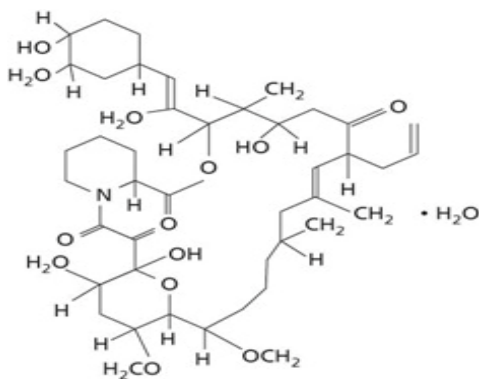
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

FK506. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente inmunosupresor, Inhibidor de la calcineurina. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Oral e inyección: inmunosupresor que se usa junto con corticosteroides para prevenir la enfermedad de injerto contra huésped en pacientes que recibieron trasplantes de órgano y que no responden a ciclosporina. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Suprime la inmunidad celular (inhibe la activación de linfocitos T), por unión a una proteína intracelular, FKBP-12 y complejos con proteínas dependientes de calcineurina para inhibir la actividad de la calcineurina fosfatasa. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** su absorción oral es errática e Incompleta (5 a 67%) (Lacy, 2011).
- **Distribución:** se distribuye en eritrocitos, leche materna, pulmón, riñones, páncreas, hígado, placenta, corazón y bazo; V^{\wedge} : 5 a 65 L/kg (su V_d es mayor en pacientes pediátricos que en adultos). (Lacy, 2011).



- **Unión a proteínas:** 99% se une a la glucoproteína acida alfa (una parte se une a albúmina). (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** el metabolismo hepático ocurre a través del sistema del citocromo P450 (CYP3A) para formar ocho posibles metabolitos (metabolito principal: 31-desmetiltacrolimus; tiene la misma actividad que el tacrolimus *in vitro*). (Lacy, 2011).
- **Biodisponibilidad:**
Oral:
Niños: 10 a 52%.
Adultos: 7 a 28%. (Lacy, 2011).
- **Vida media, eliminación:** 3.5 a 40.5 h (promedio: 8.7 h). (Lacy, 2011).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:**
oral: 1 a 4 h. (Lacy, 2011).
- **Eliminación:** sobre todo en bilis; < 1% se excreta sin cambios en la orina. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** en heces (93%); orina (< 2% como fármaco sin cambio). (Lacy, 2011).

DOSIS:

Niños:

Oral: 0.15 a 0.4 mg/kg/día divididos en dosis cada 12 h; por lo general los niños requieren dosificaciones de mantenimiento más altas con

base en mg/kg que los adultos. (Taketomo, 2009).

Trasplante hepático: inicial: 0.15 a 0.2 mg/kg/día divididos en dosis cada 12 h. (Taketomo, 2009).

Infusión IV continua: 0.03 a 0.15 mg/kg/día. (Taketomo, 2009).

Adultos:

Oral: 0.15 a 0.3 mg/kg/día divididos en dosis cada 12 h. (Taketomo, 2009).

Trasplante hepático: Inicial: 0.1 a 0.15 mg/kg/día divididos en dosis cada 12 h. (Taketomo, 2009).

Trasplante renal: inicial: 0.2 mg/kg/día divididos en dosis cada 12 h. (Taketomo, 2009).

Infusión IV continua: 0.03 a 0.1 mg/kg/día. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

hipersensibilidad a Tacrolimus o a cualquier componente de la formulación. (Lacy, 2011).

Precauciones: Usar con cautela y modificar la dosis en pacientes con disfunción hepática o renal. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Los niveles de Tacrolimus en suero aumentan cuando se administra al mismo tiempo que Diltiacem,



Verapamil, Nifedipina, Fluconazol, Itraconazol, Ketoconazol, Cimetidina, Claritromicina, Eritromicina, Metilprednisolona, Omeprazol, Nefazodona, Cisaprida, Inhibidores de la proteasa, Metoclopramida, Ciclosporina y Clotrimazol por vía oral; los niveles de Tacrolimus en suero se reducen cuando se administra junto con Antiácidos, Colestiramina, Sulfonato de Poliestireno Sódico, Carbamacepina, Fenobarbital, Primidona, Fenitoína, Rifabutina, Rifampicina y Hierba de San Juan; Nefrotoxicidad aditiva con que antiinflamatorios. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: hipertensión, hipotensión, edema periférico, dolor torácico, hipertrofia miocárdica, angina de pecho, palpitaciones, insuficiencia cardiaca congestiva, arritmias, miocardiopatía obstructiva hipertrófica, trombosis. (Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: encefalopatía, cefalea, alucinaciones, agitación, dolor, fiebre, convulsiones, alteración de la función mental, insomnio, mareo, depresión. (Lacy, 2011).

Dermatológicas: prurito, exantema, síndrome de Stevens-Johnson, fotosensibilidad, cáncer de piel. (Lacy, 2011).

Endocrinas y metabólicas: hiperpotasemia hiperglucemia, hipomagnesemia,

hipofosfatemia, hipercalcemia, hipercolesterolemia, síndrome de Cushing. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales: diarrea, náusea, vómito, constipación, dispepsia, pancreatitis, hemorragia gastrointestinal. (Lacy, 2011).

Genitourinarias: disuria, hematuria, albuminuria, nicturia, cistitis, oliguria. (Lacy, 2011).

Hematológicas: anemia, trombocitopenia, leucocitosis, eosinofilia. (Lacy, 2011).

Hepáticas: efectos hepatotóxicos; elevación de aminotransferasas de alanina y aspartato, y deshidrogenasa láctica. (Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: temblores, parestesias, dorsalgia, artralgias, mialgias.²

Oculares: visión anormal. (Lacy, 2011).

Óticas: tinnitus, sordera. (Lacy, 2011).

Renales: efectos nefrotóxicos, elevación de nitrógeno ureico en sangre y creatinina en suero, oliguria. (Lacy, 2011).

Respiratorias: derrame pleural, síndrome disneico, tos. (Lacy, 2011).

Diversas: mayor susceptibilidad a infecciones, trastornos linfoproliferativos, anafilaxia (puede



deberse al vehículo inyectable de aceite de ricino hidrogenado polioxil 60), síndrome urémico hemolítico. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **C.** (Lacy, 2011).
- El alimento disminuye su velocidad y grado de absorción 27%; el jugo de toronja incrementa el nivel sanguíneo de tacrolimus. (Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALITICAS:

Valores de prueba:
Los valores de la alanina aminotransferasa (ALT) y Fosfatasa alcalina y aspartato aminotransferasa pueden ser aumentados e indicar hepatotoxicidad. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Las concentraciones de bilirrubina en suero pueden aumentar e indicar hepatotoxicidad. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Las concentraciones de Calcio y Magnesio se pueden disminuir. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTOXICACION Y SU TRATAMIENTO:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, llame a un Centro de Control de Envenenamientos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Existe poca literatura sobre los efectos de las sobredosis masivas de Tacrolimus en los seres humanos. La mayoría de los pacientes no desarrollan síntomas asociados con la sobredosis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento:

El tratamiento es sintomático y de apoyo. Los pacientes en quienes se confirma o sospecha de sobredosis intencional deben ser referidos a consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2762-2763.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1577-1580.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1176-1177.



TACROLIMUS

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

Tacrolimus.

FORMA FARMACEUTICA:

Ungüento tópico.

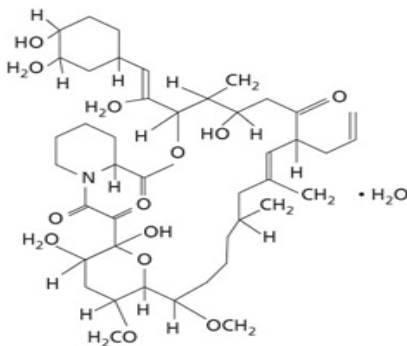
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Sinónimos: fk-506, fr900506, prograf, protopic. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Inhibidor de la calcineurina, producto dermatológico tópico. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martin Dale 2009

INDICACIONES:

Dermatitis atópica moderada a grave en pacientes que no responden a terapia o cuando la terapia convencional no es adecuada. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Suprime la inmunidad celular (inhibe la activación de linfocitos T), por unión a una proteína intracelular, FKBP-12 y complejos con proteínas dependientes de calcineurina para inhibir la actividad de la calcineurina fosfatasa. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** se absorbe muy poco; las concentraciones en suero varían desde indetectables hasta 20 mg/ml (2 mg/ml en la mayoría de los pacientes adultos estudiados). (Lacy, 2011).

DOSIS:

Tópica: dermatitis atópica (moderada a grave):

Niños \geq 2 años: aplicar la mínima cantidad de ungüento al 0.03% en la zona afectada 2 veces/día; frotar con



suavidad y de manera completa. Interrumpir el empleo cuando los síntomas hayan mejorado. Si no hay mejoría en un periodo de 6 semanas, se debe reexaminar a los pacientes para confirmar diagnóstico. (Lacy, 2011).

Adultos: aplicar la mínima cantidad de ungüento al 0.03 o 0.1% en la zona afectada 2 veces/día, frotar con suavidad y de manera completa. Interrumpir cuando se hallan mejorado los síntomas. Si en un periodo de 6 semanas no hay mejoría, se debe reexaminar al paciente para confirmar diagnóstico. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: hipersensibilidad a Tacrolimus o a cualquier componente de la formulación. (Lacy, 2011).

Precauciones: Evitar su aplicación en enfermedades dermatológicas premalignas (p. ej., linfoma cutáneo T). No se debe administrar en pacientes inmunocomprometidos. No aplicar en áreas de infección activa bacteriana o viral; las infecciones en el sitio de tratamiento deben ser resueltas antes de iniciarlo. Los pacientes con dermatitis atópica están predispuestos a infecciones de la piel, y el tratamiento con Tacrolimus se ha asociado con riesgo de desarrollar eccema herpético, varicela zoster y herpes simple. No se recomienda emplear en pacientes con enfermedad dermatológica que pueda

incrementar la absorción sistémica (p. ej., síndrome de Netherton). Minimizar la exposición a la luz solar durante el tratamiento. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante de Tacrolimus (tópico) con cualquiera de los siguientes: inmunosupresores. (Lacy, 2011).

Puede incrementar las concentraciones/efectos de : Alcohol (Etilico); Ciclosporina; Inmunosupresores; Sirolimus; Temsirolimus. (Lacy, 2011).

Las concentraciones pueden estar aumentadas por: antidepresivos (inhibidores/antagonistas de la recaptación de serotonina); agentes antimicóticos (derivados Azoles, sistémicos); antagonistas de los canales del Calcio (no Dihidropiridinicos; Fluconazol; jugo de toronja; Antibióticos Macrólidos; inhibidores de la proteasa, Sirolimus, Temsirolimus. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Como se reportan para niños y adultos, a menos que se indique algo más. (Lacy, 2011).

10%:
Sistema nervioso central: cefalea, fiebre. (Lacy, 2011).

Dermatológicas: sensación de ardor en la piel, tiende a mejorar a



medida que la lesión se resuelve, prurito, eritema. (Lacy, 2011).

Respiratorias: tos aumentada. (Lacy, 2011).

Misceláneo: síndrome tipo influenza, reacción alérgica. (Lacy, 2011).

1 a 10%:

Cardiovasculares: edema periférico. (Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: hiperestesia, dolor. (Lacy, 2011).

Dermatológicas: sensación de hormigueo en la piel, bochorno localizado (después de consumo de etanol; foliculitis, urticaria, exantema, exantema pustular, exantema vesiculoampuloso, dermatitis por contacto, quiste, eccema herpético, dermatitis micótica, eritema solar, piel seca. (Lacy, 2011).

Endocrinas y metabólicas: dismenorrea. (Lacy, 2011).

Gastrointestinales: diarrea, dispepsia, dolor abdominal, vómito, gastroenteritis, náusea, trastorno dental. (Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: parestesia, mialgia, debilidad, artralgia, dolor de espalda. (Lacy, 2011).

Oculares: conjuntivitis. (Lacy, 2011).

Óticas: otitis media. (Lacy, 2011).

Respiratorias: rinitis, sinusitis, bronquitis, neumonía. (Lacy, 2011).

Misceláneo: varicela/herpes zoster. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **C** (Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALITICAS:

Valores de prueba: Los valores de la alanina aminotransferasa (ALT) y Fosfatasa alcalina y aspartato aminotransferasa pueden ser aumentados e indicar hepatotoxicidad. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Las concentraciones de bilirrubina en suero pueden aumentar e indicar hepatotoxicidad. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Las concentraciones de Calcio y Magnesio se pueden disminuir. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTOXICACION Y SU TRATAMIENTO:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, llame a un Centro de Control de Envenenamientos. (Drug



Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Existe poca literatura sobre los efectos de las sobredosis masivas de Tacrolimus en los seres humanos. La mayoría de los pacientes no desarrollan síntomas asociados con la sobredosis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento:

El tratamiento es sintomático y de apoyo. Los pacientes en quienes se confirma o sospecha de sobredosis intencional deben ser referidos a consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2762-2763.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1577-1581.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15^a Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1176-1177.

TARTRATO DE TOLTERODINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Tartrato de tolterodina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

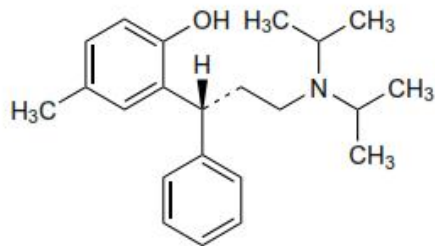
(+)-(R)-2- { a-[2- Diisopropilamino) etil]benzil}-*p*-cresol tartrato. (Martindale, 2009).

Sinónimos: Tartrato de Tolterodina. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente Anticolinérgico. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tartrato de Tolterodina es un Antimuscarínico terciario con acciones similar a los de la Atropina; se le atribuye a tener una mayor selectividad para los receptores Muscarínicos de la vejiga. La Tolterodina se utiliza en la administración de la frecuencia urinaria, urgencia, y la incontinencia debido a la inestabilidad del musculo detrusor. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

La Tolterodina es un Antagonista competitivo de receptores Muscarínicos. En modelos animales la Tolterodina muestra selectividad por receptores de la vejiga es mediada por receptores Muscarínicos. La Tolterodina aumenta el volumen de orina residual y disminuye la presión del Musculo detrusor. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** tabletas de liberación inmediata, rápida $\geq 77\%$. (Lacy, 2011).
- **Distribución:** IV: Vd: 113 ± 27 L.



- **Unión a proteínas:** > 96% (principalmente a la Glicoproteína Alfa 1 Acida). (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** Hepático extenso, principalmente a través de CYP2D6 a 5- hidroximetil tolterodina (activo) y 3 A 4 por lo general (vía menor). En pacientes con deficiencia genética de CYP2D6 predomina el metabolismo 3 A 4. (Lacy, 2011).
- **Biodisponibilidad:** tabletas de liberación inmediata: aumenta a 53% con alimentos. (Lacy, 2011).
- **Vida media de eliminación:**
En tabletas de liberación inmediata de 2 a 10 horas. (Lacy, 2011).

Capsulas de liberación prolongada de 7 a 18 horas. (Lacy, 2011).
- **Tiempo de concentración máxima:**
Tabletas de liberación inmediata es de 1 a 2 horas. (Lacy, 2011).

Tabletas de liberación prolongada es de 2 a 6 horas. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** en orina (77%), en heces (17%), principalmente como metabolitos (< 1% del fármaco sin cambios) de los que el metabolitos activo 5- hidroximetil contribuye con 5 a 14% (< 1% en metabolismo

deficiente), como fármaco sin cambios (< 1%; < 2.5% en metabolismo deficiente). (Lacy, 2011).

DOSIS:

ORAL:

Adultos: tratamiento de la vejiga hiperactiva:

2 mg cada 12 h; la dosis se puede disminuir a 1 mg cada 12 horas con base en la respuesta y la tolerabilidad individual. (Lacy, 2011).

Ajuste de dosis en pacientes que actualmente toman inhibidores de la CYP3A4: 1 mg cada 12 h. (Lacy, 2011).

Capsula de liberación prolongada: 4 mg 1 vez al día; lo dosis puede disminuir a 2 mg diarios con base en la respuesta de tolerabilidad individual. (Lacy, 2011).

Ajuste de dosis en pacientes que toman inhibidores de CYP3A4 de forma concurrente: 2 mg al día. (Lacy, 2011).

Ancianos: se encontró que la seguridad y la eficacia en pacientes > de 64 años eran similares a las de los más jóvenes, no se necesita ajuste de dosis con base en la edad. (Lacy, 2011).



CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Tolterodina o cualquier componente de la formulación retención urinaria, retención gástrica glaucoma de Angulo estrecho no controlado. (Lacy, 2011).

Puede causar mareo y visión borrosa, que alteran las capacidades físicas o mentales, se deben precaver a los pacientes acerca de la realización de tareas que requieren alerta mental (manejar maquinaria pesada o conducción de vehículos). Usar con precaución en pacientes con obstrucción del flujo vesical, puede aumentar el riesgo de retención urinaria. (Lacy, 2011).

Precauciones:

Utilizar con cautela en pacientes con trastornos obstructivos gastrointestinales (es decir, estenosis del píloro), puede aumentar el riesgo de retención gástrica. Usar con cuidado en pacientes con miastenia grave y glaucoma de Angulo estrecho (tratado controlado) se degrada en el hígado y se excreta en la orina y las heces, se requiere ajuste de dosis en pacientes con disfunción renal y hepática. La Tolterodina se ha vinculado con prolongación del QTc a dosis altas (supraterapéuticas). El fabricante recomienda precaución en pacientes con prolongación

congenia de QT o en aquellos que reciben tratamiento concomitante con fármacos que prolongan el QTc (Antiarrítmicos de clases Ia o III). Sin embargo el cambio promedio de QTc incluso a dosis supraterapéuticas, fue menor a 15 ms. Los individuos con mal metabolismo de CYP2B6 o con presencia de inhibidores de CYP2B6 y CYP3A4 pueden tener más probabilidad de mostrar la prolongación. Se recomienda ajustar la dosis en pacientes que reciben inhibidores de CYP3A4 (se sugiere una dosis menor de Tolterodina). No se han establecido su seguridad y eficacia en pacientes pediátricos. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Hay un riesgo de interacciones entre Tolterodina y fármacos que inhiben las isoenzimas del citocromo P450, CYP2D6 o CYP3A4. Y con inhibidores potentes de CYP3A4 (por ejemplo, los Antibacterianos Macrólidos Eritromicina o Claritromicina, o Antifúngicos, Azoles, Ketoconazol, Itraconazol, o Miconazol). La información de productos de RU no se recomienda en estas combinaciones (Lacy, 2011)..

EFFECTOS ADVERSOS:

Las reacciones adversas corresponden a las informadas con tabletas de liberación inmediata, a



menos que se especifique lo contrario. 4

Cardiovasculares: dolor torácico (2%), angiedema, palpitaciones, edema periférico, prolongación del QTc, taquicardia. (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: cefalea (7%; capsulas de liberación prolongada: 6%), somnolencia (3% capsulas de liberación prolongada: 3%), fatiga (4%; capsulas de liberación prolongada: 2%) ansiedad (capsulas de liberación prolongada 1%), confusión, desorientación, alucinaciones, trastornos de la memoria, comportamiento agresivo e hiperactivo anormal (niños de 3%). (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: sequedad en piel (1%). (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: ganancia ponderal (1%). (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: sequedad de boca (35%; capsulas de liberación prolongada: 23%), dolor abdominal (5%; capsulas de liberación prolongada: 4%), constipación (7%; capsulas de liberación prolongada: 6%), dispepsia (4%; capsulas de liberación prolongada: 3%) diarrea (4%). (Taketomo, 2009).

Genitourinarias: disuria (2%; capsulas de liberación prolongada 1%). (Taketomo, 2009).

Neuromusculares: artralgias (2%). (Taketomo, 2009).

Oculares: anormalidades de la visión (2%; capsulas de liberación prolongada: 1%), Xeroftalmia (3%; capsulas de liberación prolongada: 2%). (Taketomo, 2009).

Renales: infecciones de vías urinarias (6.6%). (Taketomo, 2009).

Respiratorias: bronquitis (2%), sinusitis (capsulas de liberación prolongada: 2%). (Taketomo, 2009).

Diversas: síndrome similar a influenza (3%), infecciones (1%), reacciones de hipersensibilidad. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

La Tolterodina se debe emplear con precaución en pacientes con insuficiencia renal o hepática. Los estudios en animales han mostrado que dosis elevadas pueden causar toxicidad fetal, a pesar de recomendaciones de que la Tolterodina se evite durante el embarazo. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

La sobredosis de Tolterodina tiene el potencial de dar lugar a graves efectos Anticolinergicos centrales y deben ser tratados en consecuencia. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



La monitorización del ECG es recomendable debido a los intervalos de QT cambios que se han observado en estudios en animales, pero no en los seres humanos en dosis de hasta 4 mg dos veces al día. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Cuando la sobredosis es intencional y se confirma o sospecha el paciente debe ser sometido a consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp.2883
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1658.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 2198.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1216



TAZAROTENO

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Tazaroteno.

FORMA FARMACEUTICA:

Gel tópico.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

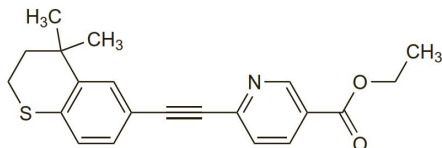
etil 6-[-(4,4-dimetiltiocromano-6-il) etinil] nicotinato. (Lacy, 2011).

Sinónimos: Tazaroteno. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente Queratolítico, Producto Dérmico Tópico contra el Acné. (Lacy, 2011)..

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

El Tazaroteno es un retinoide utilizado para el tratamiento tópico de acné leve a moderado y la psoriasis de placa, y tratar los signos de fotoenvejecimiento. (Martindale, 2009).

En el tratamiento de la Psoriasis se aplica un Gel de Tazaroteno al 0.05 o al 0.1% una vez al día, por la noche. En el RU, el Tazaroteno está autorizado para tratar a pacientes con psoriasis que afecte hasta el 10% de la superficie corporal; en EE.UU. se utiliza en psoriasis que implique hasta el 20% de la superficie corporal. (Martindale, 2009)

En el tratamiento del acné, el Tazaroteno se aplica en forma de gel al 0.1% una vez al día al anochecer. (Martindale, 2009).

En el inicio del tratamiento puede haber exacerbación del acné, o de la psoriasis en cualquier momento. (Martindale, 2009)

El periodo de tratamiento suele ser de hasta 12 semanas, aunque el tratamiento de la psoriasis se utiliza hasta 12 meses. (Martindale, 2009).



FARMACODINAMIA:

Mecanismo de Acción: El Tazaroteno es un profármaco que es desesterificada en la piel a su forma activa, el Ácido Tazaroténico. (Lacy, 2011).

El mecanismo de acción es desconocido pero al parecer modula la proliferación y diferenciación celular. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** (sin oclusión): adultos pacientes con psoriasis: < 1%; controles normales: < 5%. (Taketomo, 2009).
- **Distribución:** después de la aplicación tópica sufre hidrólisis por esterasas, para formar su metabolito activo. (Taketomo, 2009).
- **Vida media:** metabolitos: 18 horas. (Taketomo, 2009).
- **Excreción:** en orina y heces, como metabolitos. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

TÓPICA:

Niños \geq 12 años y adultos:

Acné: Tazaroteno gel al 0.1%: limpiar la cara con suavidad. Una vez que la piel este seca, aplicar

una capa delgada de tazaroteno (2mg/cm²) una vez al día, por la tarde, en la piel donde se encuentran las lesiones de acné, utilizar suficiente para cubrir toda la zona afectada. (Lacy, 2011).

Psoriasis: Tazaroteno gel al 0.05 o 0.1%: aplicar una vez al día, por la tarde a las lesiones psoriáticas con suficiente cantidad (2mg/cm²) para cubrir solo la lesión con una capa delgada a no más del 20% de la superficie de la aplicación, secar la piel antes de aplicar. La piel sana puede ser más susceptible a la irritación, evitar aplicar en estas áreas. (Lacy, 2011).

Niños \geq 17 años y adultos: atenuación de las arrugas faciales finas, manchas de la piel hiper/hipo pigmentación, lentigos faciales benignos: aplicar una cantidad del tamaño de un chicharo una vez al día para limpiar la piel seca a la hora de dormir; si desea se puede cubrir ligeramente toda la cara, incluidos los parpados. Los emolientes o cremas hidratantes se pueden aplicar antes o después; si el Tazaroteno se aplica antes, asegurarse de que la crema o loción ha sido absorbida por la piel y se ha secado por completo. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

El tazaroteno es toxico para el feto y teratógeno en animales. No se han realizado suficientes estudios con embarazos en humanos. (Lacy, 2011).



Precauciones:

Debe administrarse con cautela a pacientes que reciben medicamentos fotosensibilizantes, porque pueden potenciar las reacciones de fotosensibilidad. (Taketomo, 2009).

Un hombre de 57 años con diabetes y psoriasis resistente al tratamiento en el tronco y las piernas sufrió una dermatitis aguda en la zona genital 2 semanas después de iniciar un tratamiento con tazaroteno al 0,1% por vía tópica. Las zonas afectadas se ulceraron a los pocos días. Se sospecho que la causa fue el contacto accidental con el Tazaroteno que el paciente se aplicaba para tratar la psoriasis localizada en el tronco. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

No se conocen interacciones significativas. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Dermatológicas: prurito, ardor, sensación punzante, eritema, agravamiento de psoriasis, irritación, dolor en piel, exantema, descamación, dermatitis de contacto por irritantes, inflamación, sequedad, fisuras, edema localizado, cambio de color. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Los retinoide no deben aplicarse a piel eccematosa porque pueden producir irritación importante; pueden causar fotosensibilidad; evitar la exposición excesiva a luz solar o lámparas de sol; las mujeres en edad reproductiva deben usar medidas anticonceptivas adecuadas; se recomienda tener una prueba negativa de embarazo en las dos semanas anteriores al inicio del tratamiento; empezar el tratamiento durante un periodo menstrual normal.

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp.1592-1593
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1617.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp.1179-1180.



TELMISARTAN

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Telmisartan.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

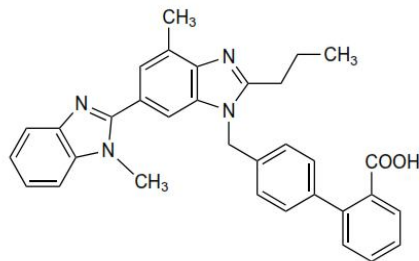
Acido-4'-((4-Metil-6-(1-metil-2-benzimidazolil)-2-propil-1-benzimidazolil)metil)-2-bifenilcarboxilico. (Martindale, 2009).

Sinónimos: Telmisartan. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Bloqueador del receptor de angiotensina II. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenett.com

www.cegimed.org

INDICACIONES:

Tratamiento de hipertensión (puede emplearse solo o en combinación con otros agentes Antihipertensivo), reducción del riesgo cardiovascular en pacientes ≥ 55 años de edad incapaces de tomar Inhibidores de la ECA y que están en gran riesgo de eventos cardiovasculares mayores, (por ejemplo MI, evento vascular cerebral, muerte). (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

La angiotensina II actúa como vasoconstrictor, además de producir vasoconstricción directa, la angiotensina II estimula la liberación de la Aldosterona. Una vez que la aldosterona es liberada se reabsorbe sodio y agua. (Lacy, 2011).

El resultado final es una elevación de la presión arterial. El Telmisartán es un antagonista II no peptídico de AT₁. Esta unión evita que la angiotensina II se una al receptor, y por tanto, bloquea la vasoconstricción y los efectos secretores de la aldosterona de la angiotensina II. (Lacy, 2011).



FARMACOCINÉTICA:

Oralmente activo no como profármaco:

- **Inicio de acción:** 1 – 2 horas. (Lacy, 2011).
- **Duración:** hasta 24 horas. (Lacy, 2011).
- **Distribución:** Vd: 500 L. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** 99.5%; principalmente a albumina y glocoproteína alfa1-acida. (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** Hepático vía conjugación a metabolitos inactivos; no se metaboliza vía CYP. (Lacy, 2011).
- **Biodisponibilidad (dependiente de la dosis):** 42 a 58%; disfunción hepática: cerca de 100%. (Lacy, 2011).
- **Vida media de eliminación, terminal:** 24 horas. (Lacy, 2011).
- **Tiempo de concentración máxima, plasma:** 0.5 a 1 hora. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** Heces (97%). (Lacy, 2011).
- **Depuración todo el organismo:** 800 mL/min. (Lacy, 2011).

DOSIS:

ADULTOS:

Hipertensión: inicial: 40 mg 1 vez/día; rango usual de dosis de mantenimiento: 20 a 80 mg/día. Se debe iniciar a los pacientes con deficiencia de volumen con la dosis más baja y supervisión cercana. (Lacy, 2011).

Reducción de riesgo cardiovascular: inicial: 80 mg 1 vez/día: Nota: no se sabe si la dosis < 80 mg/día están asociadas con reducción del riesgo cardiovascular de morbilidad o mortalidad. (Lacy, 2011).

Ancianos:

Hipertensión: inicial: 20 mg/día; rango usual de dosis de mantenimiento: 20 a 80 mg/día. (Lacy, 2011).

Reducción del riesgo cardiovascular: inicial 80 mg 1 vez/día. (Lacy, 2011).

Ajuste de dosis en disfunción renal: no se requiere ajustar; los pacientes en hemodiálisis son más susceptibles a hipotensión ortostática. (Lacy, 2011).

Ajuste de dosis en disfunción hepática: iniciar tratamiento con dosis baja; titular con lentitud y vigilar de cerca. (Lacy, 2011).



CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

No hay contraindicaciones señaladas en la etiqueta del fabricante. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Efectos del metabolismo/transporte inhibe CYP2C19 (débil). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Nitrógeno Ureico en Sangre (BUN) y Creatinina en el suero sanguíneo:

- Se incrementa la Creatinina en el suero 0.5 mg por dL o generalmente ocurren en 0.4% de los pacientes tratados con Telmisartan, un paciente que discontinúa el tratamiento con Telmisartan puede incrementar el nivel de Creatinina y Nitrógeno Ureico en sangre. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Colesterol:** Incremento marcado del colesterol se reportaron 6 pacientes (0.4%) de los tratados con Telmisartan, dos de estos pacientes fueron seguidos luego del tratamiento y los niveles de colesterol retornaron a los valores normales. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Pueden estar asociadas con empeoramiento de la función renal en pacientes dependientes del sistema renina-angiotensina-aldosterona 1 a 10%. (Taketomo, 2009).

Cardiovasculares: claudicación intermitente (7%; placebo 6%), dolor torácico ($\geq 1\%$), hipertensión ($\geq 1\%$), edema periférico ($\geq 1\%$). (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: desvanecimiento ($\geq 1\%$), fatigas ($\geq 1\%$), cefalea ($\geq 1\%$), dolor ($\geq 1\%$).

Dermatológicas: Úlcera cutánea (3%; placebo 2%). (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: diarrea (3%), abdominal dolor ($\geq 1\%$), dispepsia ($\geq 1\%$), náusea ($\geq 1\%$). (Taketomo, 2009).

Genitourinarias: infección de las vías respiratorias superiores (7%), sinusitis (3%), tos ($\geq 1\%$), faringitis (1%). (Taketomo, 2009).

<1% (limitado a las importantes o potencialmente mortales): ECG anormal, visión anormal, absceso, reacción alérgica, anemia, angina, angioedema, edema angioneurotico, ansiedad, artralgia, artritis, asma, fibrilación auricular, bradicardia, bronquitis, BUN aumentado, trastornos cerebro vasculares, CHF, conjuntivitis, estreñimiento, calambres, creatinina



aumentada, cistitis, depresión dermatitis, diabetes mellitus, diaforesis, disnea, dolor del oído, eccema, edema, enteritis, epistaxis, esoinofilia, disfunción eréctil, eritema, edema facial, fiebre, flatulencia, bochorno, polaquiuria, infección micótica, gastroenteritis, gota, hemoglobina disminuida, hemorroides, disfunción hepática, hipercolesterolemia, hipotensión, hiperpotasemia, hipersensibilidad, impotencia, insomnio, enzimas hepáticas aumentadas, malestar general, MI, migraña calambres musculares, nerviosismo, hipotensión ortostática (más frecuente en pacientes en diálisis), otitis media, palpitación, parestesia, prurito, disfunción renal, insuficiencia renal, rhabdomiolisis, exantema, reflujo, rinitis, creatinina en suero aumentada, somnolencia, síncope, taquicardia, dolor tendinoso, tendinitis, tenosinovitis, trombocitopenia, acufenos, dolor dental, ácido úrico aumentado, urticaria, vértigo, vómitos, debilidad, xerostomía. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Los fármacos que actúan en el sistema angiotensina pueden ocasionar lesión y muerte del feto en desarrollo cuando se consumen durante el segundo y tercer trimestre. Los bloqueadores del receptor de la angiotensina deben suspenderse tan pronto como sea posible una vez que se diagnostique embarazo. (Lacy, 2011).

Puede ocasionar Hiperpotasemia, evitar la suplementación de Potasio a menos que de manera específica lo requiera el médico. (Lacy, 2011).

Evitar administrarlo o emplear dosis menores en pacientes en quienes el volumen es insuficiente, primero corregir este problema. Puede estar asociado con deterioro de la función renal y/o incremento de la creatinina en suero, sobre todo en pacientes con bajo flujo sanguíneo renal. (Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Agudos o crónicos:

Bradycardia (latidos lentos del corazón) es un resultado de la estimulación del sistema parasimpático (vagal), Desinencia, hipotensión, taquicardia. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento de sobredosis:

El tratamiento es sintomático

Pacientes en los cuales se confirma sobredosis intencional, deben ser referidos a un psicólogo. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2773.



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp.1596-1597.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1409.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1216.



TEOFILINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Teofilina.

FORMA FARMACEUTICA:

Capsulas con gránulos de liberación prolongada.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

3,7-Dihidro-1,3-dimetilpurina-2,6(1H)-diona. (Martindale, 2009).

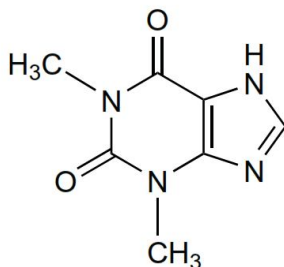
Sinónimos:

1,3 Dimetilxantina. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Broncodilatador. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007)

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento de los síntomas y la obstrucción reversible de las vías respiratorias por el asma crónica, otras enfermedades pulmonares crónicas, apnea de la premadurez. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

Causa broncodilatación, diuresis, estimulación cardiaca, del SNC y de la secreción gástrica, por bloqueo de la fosfodiesterasa, que aumenta la concentración tisular del monofosfato cíclico de adenina (cAMP), que a su vez promueve la estimulación de la lipólisis, glucogenólisis y gluconeogénesis por catecolaminas, e induce la secreción de epinefrina por células de la medula suprarrenal. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** oral: dependiente de la forma farmacéutica. (Lacy, 2011).
- **Distribución:** 0.45 L/kg (rango: 0.3 a 0.7 L/kg) con base en el peso corporal ideal; se distribuye poco hacia la grasa corporal; el Vd puede aumentar en recién nacidos prematuros, pacientes con cirrosis hepática, academia



(no corregida) y ancianos.
(Lacy, 2011).

- **Metabolismo:** niños > 1 año y adultos: Hepático; incluye CYP1A2, 2E1 y 3A4; forma metabolitos activos (Cafeína y 3-Metilxantina). (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** 40%, principalmente a Albumina. (Lacy, 2011).
- **Vida media de eliminación:** altamente variable y dependiente de edad, función hepática, función cardíaca, enfermedades pulmonares y los antecedentes de tabaquismo. (Lacy, 2011)

Lactantes prematuros, edad posnatal de 3 a 15 días: 30 h (límites: 17 a 43 h). (Lacy, 2011).

Lactantes prematuros, edad posnatal de 25 a 57 días: 20 h (límites: 9.4 a 30.6 h). (Lacy, 2011).

Niños 6 a 17 años de edad: 3.7h (límites: de 1.5 a 5.9 h). (Lacy, 2011).

Adultos 16 a 60 años con asma, que no fuman, por lo demás sanos: 8.7 h (límites: 6.1 a 12.8 h). (Lacy, 2011).

- **Tiempo de concentración sérica máxima:**

Tableta, sin cubierta 2 h. (Lacy, 2011).

- **Excreción:** en orina. (Lacy, 2011).

Recién nacidos: 50% como Teofilina sin cambios. (Lacy, 2011).

Niños > 3 meses y adultos: aproximadamente 10%, como Teofilina sin cambios. (Lacy, 2011).

DOSIS:

DOSIS DE IMPREGNACIÓN:

Neonatos:

Apnea de la prematuridad: 4 mg/kg/dosis. (Taketomo, 2009).

Lactantes y niños: tratamiento del broncoespasmo agudo: (para alcanzar un valor en suero de aproximadamente 10 mcg/mL; deben administrarse dosis de impregnación utilizando un producto oral de absorción rápida, no un producto de liberación sostenida): Si no se administró Teofilina en las 24 h previas: 5 mg/kg de Teofilina. (Taketomo, 2009).

Si se administró Teofilina en las 24 h previas: pueden administrarse en urgencias 2.5 mg de Teofilina/kg cuando no se conocen los niveles séricos. (Taketomo, 2009).



Puede calcularse una dosis de impregnación modificada (mg/kg) (cuando se conocen los niveles séricos) mediante la siguiente fórmula: (nivel sanguíneo deseado - nivel cuantificado) dividido entre 2 (por cada 1 mg/kg administrado de Teofilina el nivel sérico aumentará aproximadamente 2 mcg/mL). (Taketomo, 2009).

Estas recomendaciones, basadas en la depuración promedio para la edad o los factores de riesgo, se calcularon para alcanzar un valor en suero de 10 mcg/mL (5 mcg/mL para recién nacidos con apnea o bradicardia). (Taketomo, 2009).

En recién nacidos y lactantes puede utilizarse un producto oral de liberación rápida.

La dosis diaria total se divide cada 12 h en recién nacidos y cada 6 a 8 h en lactantes. En niños y adultos sanos puede emplearse un producto de liberación lenta. Es posible dividir la dosis diaria total en fracciones a intervalos de 8 a 12 h. (Taketomo, 2009).

Utilizar el peso corporal ideal en pacientes obesos. (Taketomo, 2009).

La dosis se ajustará más con base en los valores en suero. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Teofilina o

cualquier componente de la fórmula. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

CYP1A2 (mayor), 2C9 (menor), 2D6 (menor), 2E1 (mayor), 3A4 (mayor), inhibe CYP1A2 (débil). (Lacy, 2011).

INTERACCIONES ANALITICAS

Puede aumentar la glucosa plasmática, Ácido Úrico, Ácidos Grasos libres, Colesterol total, HDL, cociente HDL/LDL, y la excreción de Cortisol libre urinario por la Teofilina, que además disminuye la Triyodotironina. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Frecuencia indefinida, se observaron eventos adversos dentro de las concentraciones séricas terapéuticas.

Cardiovasculares: aleteo, taquicardia. (Lacy, 2011).

Sistema Nervioso Central: Cefalea, hiperactividad (niños), insomnio, inquietud, convulsiones. (Lacy, 2011).

Endocrinas metabólicas: Hipercalcemia (con enfermedad Hipotiroidea concomitante). (Lacy, 2011).



Gastrointestinales: Nausea, reflujo o agravación de una ulcera, vomito. (Lacy, 2011).

Genitourinarias: micción difícil (en hombres de edad avanzada con prostatismo). (Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: escalofríos con temblor. (Lacy, 2011).

Renales: diuresis (transitoria). (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Si un paciente presenta signos y síntomas de toxicidad por Teofilina (por ejemplo vómitos persistentes, repetitivos), deben determinarse las cifras de Teofilina Sérica e interrumpir las dosis subsecuentes. (Lacy, 2011).

Debido a la saturación potencial de la depuración de Teofilina con cifras séricas (en algunos pacientes) dentro de límites terapéuticas o menores, su ajuste debe hacerse en pequeños incrementos (máximo: 25%). (Lacy, 2011).

Debido a la amplia variabilidad entre pacientes, las determinaciones de las cifras séricas de Teofilina deben utilizarse para optimizar el tratamiento y prevenir una toxicidad grave. (Lacy, 2011).

Tener precaución en pacientes con ulcera péptica Hipertiroidismo, trastornos convulsivos y aquellos con taquiarritmias, su uso puede

exacerbar estos trastornos la depuración de Teofilina puede disminuir en pacientes con edema pulmonar agudo, insuficiencia cardiaca congestiva, cardiopatía pulmonar, fiebre, enfermedad hepática, hepatitis aguda, cirrosis, hipotiroidismo, septicemia con insuficiencia de órganos múltiples y choque, la depuración también puede disminuir en recién nacidos, lactantes menores de 3 meses de edad con disminución de la función renal, niños menores de 1 año de edad, individuos mayores de 60 años de edad y después del cese del tabaquismo. (Lacy, 2011).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp 685.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1608.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp.1140.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1448-1450.



TERAZOSINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Terazosina.

FORMA FARMACEUTICA:

Comprimido.

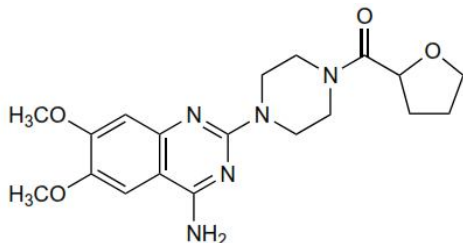
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

1-(4-amino-6,7-dimetoxi-2-quinazolinil)-4[tetrahydro-2-furanil]carbóbil]-Piperazina monoclohidrato, dihidratado. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Bloqueador alfa 1. (Martindale, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento de la hipertensión leve a moderada, sola o en combinación con otros agentes, como Diuréticos y Beta bloqueadores; Hiperplasia Prostática Benigna (BPH). (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

Agente bloqueador específico alfa1 con mínimos efectos alfa2; esto permite el bloqueo postsináptico periférico con el decremento resultante en el tono arterial, en tanto conserva el asa de retroalimentación negativa que es mediada por los receptores alfa2 presinápticos periféricos; la terazosina relaja el músculo liso del cuello vesical, por lo tanto disminuye la obstrucción de salida de la vejiga. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Inicio de acción:** 1 a 2 h. (Lacy, 2011)
- **Absorción:** rápida y completa. (Lacy, 2011)
- **Unión a proteínas:** 90 a 95%. (Lacy, 2011)
- **Metabolismo:** hepático; mínimo de primer paso. (Lacy, 2011)



- **Vida media, eliminación:** aproximadamente 12 h. (Lacy, 2011)
- **Tiempo de concentración sérica máxima:** aproximadamente 1 h. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** en heces aproximadamente (60%, 20% como fármacos sin cambios); en orina aproximadamente (40%, 10% como fármaco sin cambios). (Lacy, 2011)

DOSIS:

ORAL:

Hipertensión:

Niños (uso no autorizado): inicial: 1 mg 1 vez/día; aumentar la dosis de manera gradual según sea necesario, hasta un máximo de 20 mg/día. (Lacy, 2011)

Adultos: inicial: 1 mg al acostarse; aumentar la dosis poco a poco hasta alcanza la presión arterial deseada, hasta 20 mg/día; intervalo de dosis usual (JNC 7): 1 a 20 mg 1 mg/día. (Lacy, 2011)

Hiperplasia Prostática Benigna:

Adultos: inicial: 1 mg al acostarse; después, ajustar en ascenso, si es necesario, durante varias semanas, sopesando el beneficio terapéutico con la hipotensión postural inducida por la Terazosina; la mayoría requiere 10 mg diarios; si no hay respuesta después de 4 a 6

semanas con dicha dosis, se puede aumentar a 20 mg/día. (Lacy, 2011).

Uso concomitante con un Diurético u otro Agente Antihipertensivo (en especial el Verapamilo): cuando se juntan se puede requerir disminución de las dosis. (Lacy, 2011).

Uso concomitante de inhibidores de PDE-5; iniciar el tratamiento con un inhibidor PDE-5 a la dosis más baja por los efectos aditivos de disminución de la presión arterial y ortostáticos. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Terazosina o cualquier componente de la formulación. (Lacy, 2011)

Precauciones:

Puede causar hipotensión ortostática significativa y síncope, en especial con la la primera dosis; anticipar un efecto similar si el tratamiento se interrumpe durante unos días, si la dosis aumenta con rapidez, o si se introduce otro Antihipertensivo (en particular Vasodilatadores) o un Inhibidor de PDE-5. (Lacy, 2011)

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante de Terazosina con cualquiera de los siguientes: Alfuzosina, Silodosina, Tamsulosina. (Lacy, 2011)



INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Al evaluar los exámenes de laboratorio:

- Los niveles de Albumina y proteínas totales pueden encontrarse decrecidos en el suero sanguíneo. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Hemoglobina, hematocrito y glóbulos blancos pueden encontrarse decrecidos en el suero sanguíneo. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

> 10%.

Sistema Nervioso Central: mareo (9 a 19%). (Lacy, 2011)

Neuromusculares y esqueléticas: debilidad muscular (7 a 11%). (Lacy, 2011)

1 a 10%

Cardiovasculares: Edema periférico (1 a 6%), hipotensión ortostática, (1 a 4%), palpitaciones ($\leq 4\%$), taquicardias ($\leq 2\%$), síncope ($\leq 1\%$). (Lacy, 2011)

Sistema nervioso central: Somnolencia (4 a 5%), vértigo (1%). (Lacy, 2011)

Gastrointestinales:

Nauseas (2 a 4%). (Lacy, 2011)

Genitourinarias:

Impotencia ($\leq 2\%$), disminución de la Libido ($\leq 1\%$). (Lacy, 2011)

Neuromusculares y esqueléticas: dolor de extremidades ($\leq 4\%$), parestesias ($\leq 3\%$), dolor dorsal ($\leq 2\%$). (Lacy, 2011)

Oculares: Visión borrosa ($\leq 2\%$). (Lacy, 2011)

Respiratorias: congestión nasal (2 a 6%), disnea (2 a 3%), sinusitis ($\leq 3\%$). (Lacy, 2011)

< 1% (limitado a las importantes o potencialmente mortales): dolor abdominal, visión anormal, reacciones alérgicas, anafilaxia, ansiedad, arritmias, artralgiás, artritis, fibrilación auricular, bronquitis, dolor torácico, conjuntivitis, estreñimiento, tos, diaforesis, diarrea, dispepsia, epistaxis, edema facial, fiebre, flatulencia, síndrome tipo influenza, gota, insomnio, síndrome de iris hipotónico transoperatorio (IFIS), trastornos articulares, mialgias, dolor cervical, faringitis, poliuria, priapismo, prurito, exantema, rinitis, dolor de hombro, trombocitopenia, acufenos, incontinencia urinaria, infección de las vías urinarias, vasodilatación, vomito, xerostomía. (Lacy, 2011).



ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Suspender si ocurren síntomas de angina o empeoran. (Lacy, 2011)

Se debe precaver a los pacientes en cuanto a realizar tareas peligrosas cuando inician un nuevo tratamiento o ajustan la dosis en forma ascendente. El cáncer de próstata debe descartarse antes de iniciar BPH. Se observó síndrome de iris hipotónico en el transoperatorio de cataratas de pacientes que estaban en tratamiento con bloqueadores alfa1 o los recibieron antes. No se ha establecido la causa y parece no haber beneficio al interrumpir el tratamiento con bloqueadores alfa antes de tales operaciones. El priapismo se ha vinculado con su uso (rara vez). (Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

El tratamiento recomendado para la sobredosis de Terazosina incluye:

Tratamiento de la insuficiencia circulatoria, o bien en caso de choque colocar al paciente en posición supina y elevando las piernas, y tener presente, que es más importante aplicar expansores de volumen porque se puede utilizar para tratar el shock seguido, si es necesario, mediante la administración de un Vasopresor. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento sintomático y de apoyo y seguimiento de balance de electrolito en el fluido sanguíneo. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp.2784.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1610-1611.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1410.

TIBOLONA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Tibolona.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

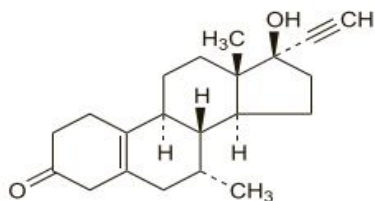
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

17β-hidroxi-7α-metil-19-nor-17α-pregn-5 (10)-en-20-in-3-ona.
 (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Estrógeno, progestágeno y andrógeno. Análogo de la noretisterona.

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

La Tibolona es un esteroide derivado del noretinodrel que tiene propiedades estrogénicas, progestágenas, y débil propiedades androgénicas. Se utiliza como tratamiento hormonal sustitutivo menopáusico para los síntomas de deficiencia de estrógenos, incluyendo síntomas vasomotores de la menopausia. La Tibolona puede También ser utilizada en la prevención de la osteoporosis postmenopáusica en mujeres con alto riesgo de fractura que no pueden ser tratados con otra terapia. La Tibolona reduce los síntomas vasomotores asociados con la utilización de análogos de la gonadorelina para la endometriosis. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Tras su administración oral se metaboliza rápidamente en 3 componentes, dos de ellos con actividad estrogénica (3-alfa y 3-beta-hidroxi derivados), mientras que el tercero es progestágeno y andrógeno. Reduce a nivel central los niveles de FSH y LH. Por consiguiente, sustituye la pérdida de producción de estrógenos en mujeres postmenopáusicas, aliviando los síntomas asociados esta deficiencia.



FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** se absorbe rápida y extensamente tras la administración oral. (Martindale, 2009).
- **Vida media:** Los dos metabolitos principales tienen una vida media de eliminación de aproximadamente 7 horas. (Martindale, 2009).
- **Metabolismo:** Se metaboliza rápidamente en tres metabolitos activos, dos de los cuales tienen actividad estrogénica principalmente, mientras que el tercero, al igual que el compuesto original, cuenta con progestágenos y actividad androgénica. (Martindale, 2009).
- **Tiempo en alcanzar la concentración máxima:** Las concentraciones máximas de la Tibolona y sus metabolitos se producen después de aproximadamente 1 a 1.5 horas. (Martindale, 2009).
- **Eliminación:** Los metabolitos son excretados en la bilis y se eliminan en las heces. Aproximadamente el 30% de una dosis se excreta en la orina. (Martindale, 2009).

DOSIS:

DOSIS ORAL

Adultos: 2,5 mg cada 24 h.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Precauciones: La Tibolona está contraindicada en mujeres con tumores hormonodependientes, enfermedades cardiovasculares o trastornos cerebrovasculares, incluyendo tromboflebitis, procesos tromboembólicos, o una historia de estas condiciones, así como también sangrado vaginal, hiperplasia endometrial, porfiria y trastornos hepáticos graves. No debe administrarse a mujeres embarazadas y no está destinada a su uso en mujeres premenopáusicas, con excepción de los que están siendo tratados con un análogo de gonadorelina. El uso de Tibolona dentro de los 12 meses de una menopausia natural no se recomienda debido a que es probable sangrado vaginal irregular. Se debe tener cuidado al dar la Tibolona a pacientes con fibromas uterinos, endometriosis, enfermedad hepática, trastornos que pueden ser exacerbados por la retención de líquidos, tales como la disfunción cardíaca o renal, hipertensión, epilepsia, o migraña, o con una historia de estas condiciones. También debe administrarse con



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



precaución en pacientes con dislipidemia o diabetes mellitus. La administración de la Tibolona debería detenerse si hay signos de enfermedad tromboembólica, un significativo aumento de la presión arterial, la nueva aparición de migraña, o si las pruebas de función hepática son anormales así como también ictericia colestática puede ocurrir. Se debe considerar detener la Tibolona 4 a 6 semanas antes de cirugía electiva, cuando vaya a existir una inmovilización prolongada después de la cirugía. (Martindale, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Los compuestos que inducen las enzimas hepáticas, como la fenitoína, carbamazepina y rifampicina, en teoría, podría mejorar el metabolismo de la Tibolona y reducir así su actividad. (Martindale, 2009).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Aumento (biológico) de bilirrubina, fosfatasa alcalina, transaminasas, gamma glutamiltransferasa y tiempo de protrombina.

Descensos de la globulina tiroidea (TBG) y T4 total. Los niveles de T3 no se modifican. Disminuye los niveles de globulina transportadora de hormonas sexuales (SHBG), mientras que los niveles de globulina transportadora de corticoides (CBG) y

el cortisol circulante no se ven afectados.

Disminución dependiente de la dosis en los niveles de HDL-colesterol (de -16,7% con la dosis de 1,25 mg a -21,8% para la dosis de 2,5 mg después de 2 años). También se redujeron los niveles de triglicéridos totales y lipoproteína (a). La disminución de los niveles de colesterol total y el VLDL-colesterol no fue dependiente de la dosis. No variaron los niveles de LDL-colesterol.

EFFECTOS ADVERSOS:

Endocrinas y metabólicas: cambios en el peso corporal. (Martindale, 2009).

Sistema nervioso central: puede presentarse mareo, cefaleas, migraña. (Martindale, 2009).

Dermatológicas: reacciones cutáneas, edema maleolar. (Martindale, 2009).

Gastrointestinales: alteraciones gastrointestinales. (Martindale, 2009).

Hepática: alteración de la función hepática. (Martindale, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: mialgia, artralgia. (Martindale, 2009).

Misceláneo: Con Tibolona se ha descrito una hemorragia vaginal

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



irregular o manchado, sobre todo durante los primeros meses de tratamiento, en especial en mujeres que experimentan una menopausia neutral y utilizan Tibolona al cabo de 12 meses de su última menstruación, crecimiento del vello facial. (Martindale, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Embarazo: la Tibolona está contraindicada en el embarazo.
- Lactancia: la Tibolona está contraindicada en la lactancia.
- Antes de iniciar el tratamiento, considerar en mujeres de mayores de 60 años, el riesgo de accidente vascular cerebral, así mismo en todas las pacientes se investigará cualquier sangrado vaginal anormal o imprevisto con o sin THS, para excluir un trastorno de malignidad.
- Advertir a la paciente que este medicamento no tiene efectos anticonceptivos ni tampoco restablecerá la fertilidad. Antes de iniciar o reinstaurar el tratamiento, realizar una historia clínica completa personal y familiar. La exploración física (incluyendo mamas y pelvis) debe de tener en cuenta esa historia clínica, las contraindicaciones y precauciones de uso.

- Realizar periódicamente exploraciones, incluyendo mamografía, de acuerdo con las guías de práctica clínica aceptadas, adaptándolas a las necesidades clínicas de cada caso.
- Debe orientarse a las mujeres acerca de qué cambios en las mamas deben comunicar a su médico.
- Las pacientes serán advertidas de que deben ponerse inmediatamente en contacto con su médico si observan síntomas tromboembólicos, si presentan hemorragias, ictericia, hipertensión arterial significativa o migraña.

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación: No es de esperar que se produzcan síntomas tóxicos, aunque se podrían producir náuseas, vómitos y sangrado vaginal.

Tratamiento para la intoxicación: el tratamiento que debe administrarse es sintomático.

REFERENCIAS:

1. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 2134-2135.

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



TICLOPIDINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Hidrocloruro de Ticlopidina.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas recubiertas.

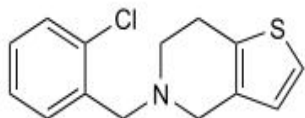
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Hidrocloruro de 5-(*o*-clorobencil)-4,5,6,7-tetrahidrotieno [3,2-*c*]piridina; Ticlopidina; Hidrocloruro de Ticlopidina. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antiplaquetario; tienopiridina. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Inhibidor de la agregación plaquetaria que disminuye el riesgo de apoplejía trombótica en pacientes que han

presentado evento vascular cerebral o sus precursores.²

Ticlopidina está indicada para reducir el riesgo de un accidente cerebrovascular recurrente tromboembólico en pacientes que han tenido un infarto cerebral trombótico. También está indicada para reducir el riesgo de un primer infarto cerebral tromboembólico en pacientes que han experimentado síntomas precursores de accidente cerebrovascular, tales como ataque isquémico transitorio, ceguera monocular transitoria (como es la ceguera fugaz), reversible, déficit neurológico isquémico (corteza), o un ictus menor. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: debido a su vínculo con trastornos hematológicos que ponen en riesgo la vida, la Ticlopidina debe reservarse para pacientes en quienes fracasó el ácido acetilsalicílico o que no lo toleran. Tratamiento adyuvante (con Ácido Acetilsalicílico) después de la implantación exitosa de una endoprótesis coronaria para disminuir la incidencia de trombosis subaguda de la endoprótesis. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Mecanismo de acción: requiere biotransformación in vivo a un metabolito activo no identificado que bloquea de manera irreversible el componente P2Y₁₂ de los receptores de ADP, lo que impide la activación del complejo receptor GPIIb/IIIa, disminuyendo así la agregación plaquetaria. Las plaquetas obstaculizadas por la Ticlopidina se ven afectadas por el resto de su lapso de utilidad.(Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Inicio de acción:** aproximadamente en 6 horas. El efecto máximo es en 3 a 5 días.(Lacy, 2011).
- **Absorción:** es absorbida rápidamente y casi por completo desde el tracto gastrointestinal.(Martindale, 2009).
- **Unión a proteínas:** fármaco original 98%; < 15% se une a la glucoproteína α_1 ácido.(Martindale, 2009).
- **Vida media:** de eliminación 13 horas.(Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático extenso; tiene al menos un metabolito activo.(Lacy, 2011).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** aproximadamente 2 horas.(Lacy, 2011).

- **Eliminación:** Alrededor del 60% de la dosis se excreta en la orina en forma de metabolitos y 25% en las heces.(Martindale, 2009).

DOSIS:

DOSIS ORAL

Adultos:

Prevención de apoplejía: 250 mg cada 12 horas.(Lacy, 2011).

Endoprótesis de arterias coronarias (inicio después de la implantación exitosa): 250 mg cada 12 horas (en combinación con dosis antiplaquetarias de ácido acetilsalicílico) durante 30 días.(Lacy, 2011).

Angina inestable, infarto miocárdico sin elevación del segmento ST en pacientes sometidos a intervención coronaria percutánea (PCI) que no pueden recibir clopidogrel (dosis no autorizada): inicial 500 mg de carga, administrada al menos 6 horas antes de la PCI, seguidos por 250 mg cada 12 horas (en combinación con 75 a 325 mg de ácido acetilsalicílico 1 vez al día). La duración del tratamiento depende del tipo de endoprótesis implantada durante la PCI.(Lacy, 2011).

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Nota: Endoprótesis de arterias coronarias: duración del uso de ticlopidina (se prefiere el clopidogrel) en combinación con ácido acetilsalicílico: de acuerdo con los lineamientos ACC/AHA/SCAI, idealmente es de 12 meses después de la colocación de la endoprótesis con elución del fármaco (DES) en pacientes sin alto riesgo de hemorragia; como mínimo, 1, 3 y 6 meses para las de metal desnudo (BMS), las de elución de Sirolimus y las de elución de Paclitaxel, respectivamente, como tratamiento ininterrumpido. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

hipersensibilidad a la Ticlopidina o cualquier componente de la formulación; hemorragia patológica activa, como en la enfermedad ulceropéptica (PUD) o la hemorragia intracraneana; disfunción hepática grave; trastornos hematopoyéticos (neutropenia, trombocitopenia, antecedente de TTP o anemia aplásica). Su uso está contraindicado en presencia de disfunción hepática grave. (Lacy, 2011).

Precauciones: usar con precaución en pacientes que pueden tener riesgo de mayor hemorragia (por ejemplo: PUD, traumatismo o intervención quirúrgica). Considerar interrumpir 10 o 14 días antes de una operación quirúrgica electiva (excepto en pacientes con endoprótesis cardíacas

que no han concluido su ciclo completo de tratamiento antiplaquetario doble). Tener precaución en el tratamiento concomitante con anticoagulantes (por ejemplo Heparina, Warfarina) u otros fármacos antiplaquetarios; el riesgo de hemorragia aumenta. Usar con cautela en pacientes con disfunción hepática leve a moderada.

Utilizar con cuidado en pacientes con disfunción renal moderada a grave; los tiempos de coagulación se pueden prolongar de manera significativa y tal vez aumente el riesgo de efectos adversos hematológicos. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Nota: Además de las interacciones que se señalan a continuación, se debe considerar la posibilidad que los efectos aditivos o múltiples que conducen a un mayor riesgo de sangrado puede ocurrir si la Ticlopidina es administrada en combinación con cualquier otro medicamento que tiene significativa actividad de inhibición de la agregación plaquetaria, o de un potencial significativo para causar hipoprotrombinemia, trombocitopenia o ulcera gastrointestinal, o hemorragia. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Antiácidos que contienen aluminio y magnesio: las concentraciones plasmáticas de Ticlopidina se

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



reducen en alrededor del 18% cuando se administra después de un antiácido que contiene aluminio y magnesio, se recomienda que la Ticlopidina y el antiácido debe ser administrada al menos 1 a 2 horas de diferencia.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Anticoagulantes, Cumarina o derivado del Indandiona, Heparina o agentes trombolíticos (tales como: Alteplasa, Anistreplasa, Estreptoquinasa, Uroquinasa): la posibilidad de efectos aditivos sobre los mecanismos de coagulación de la sangre que llevan a un mayor riesgo de hemorragia no se puede descartar, la monitorización clínica y un especial cuidado de el paciente se recomienda si el uso concomitante es necesario.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Aspirina o medicamentos antiinflamatorios no esteroideos (AINE) o inhibidores de la agregación de plaquetas, y otros: el uso concomitante de Ticlopidina con estos fármacos puede aumentar el riesgo de sangrado debido a la inhibición aditiva de la agregación plaquetaria, también, la posibilidad de que la Aspirina o (AINE) inducen ulceración o hemorragia gastrointestinal.

El uso concomitante de Ticlopidina y la Aspirina no se recomienda.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Fenitoína: varios casos de elevación de las concentraciones plasmáticas

de Fenitoína asociada con somnolencia y letargo se han reportado después de la administración de ticlopidina.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Xantinas (como la Aminofilina, Oxtrifilina, Teofilina): De la Teofilina la vida media de eliminación puede aumentar en un 40%, y el aclaramiento plasmático total de teofilina se disminuye en aproximadamente un 35% cuando una xantina se administra a un paciente que está recibiendo ticlopidina.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Endocrinas y metabólicas: aumento del colesterol total (incremento de aproximadamente 8 a 10% en el mes siguiente al inicio del tratamiento), aumento de triglicéridos, estos efectos son los que se presentan en un mayor porcentaje.(Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: en un porcentaje muy bajo puede presentarse mareo.(Lacy, 2011).

Dermatológicas: exantema, purpura, prurito.(Lacy, 2011).

Gastrointestinales: diarrea es la que se presenta con mayor frecuencia, náusea, dispepsia, dolor gastrointestinal, vómito, flatulencia, anorexia.(Lacy, 2011).

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Hematológicas: neutropenia es presentado rara vez. (Lacy, 2011).

Hepática: aumento de la fosfatasa alcalina (>2 por el límite superior normal), y rara vez pruebas de función hepática anormales. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: B. (Lacy, 2011).
- Lactancia: se desconoce su excreción en la leche materna. (Lacy, 2011).
- Medicamentos que corresponde a los criterios de Beers: este fármaco puede ser inapropiado para usarse en pacientes Geriátricos (riesgo alto de gravedad). (Lacy, 2011).
- Interacción con alimentos: la biodisponibilidad de la Ticlopidina puede aumentar (20%) si se toma con alimentos. Las comidas ricas en grasas aumentan la absorción, los antiácidos la disminuyen. (Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Signos de efectos secundarios potenciales, especialmente erupciones en la piel, las complicaciones de sangrado, picor de

la piel, neutropenia, agranulocitosis, púrpura, hepatitis o ictericia colestática, urticaria, zumbido en los oídos, eritema multiforme, síndrome Stevens-Johnson y dermatitis exfoliativa, trombocitopénica y purpura trombocitopénica trombótica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento para la intoxicación:

Consiste en lo siguiente:

- En general: la monitorización del paciente y la institución de medidas de apoyo según sea necesario.
- Complicaciones hemorrágicas: aunque la administración de Metilprednisolona (20 mg, por vía intravenosa) devuelve el tiempo de sangrado a la normalidad en los pacientes tratados con Ticlopidina, la experiencia clínica indica que este tratamiento mejora la hemostasia.

Transfusiones de plaquetas puede ser útil, aunque normalmente no son indicados para la púrpura trombocitopénica trombótica que ocurre en pacientes que toman Ticlopidina.

Además, otras medidas para controlar el sangrado en áreas específicas deben ser empleadas como sea necesario. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2855-2859.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp. Pp. 1627-1629.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1411-1412.

TINIDAZOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Tinidazol.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

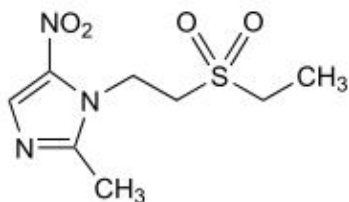
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Tinidazol; Tinidazolas;
1 - [2 - (etilsulfonilo) etil]-2-metil-5-
nitroimidazol. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERA- PÉUTICA:

Antiparasitario. (Martindale, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

El Tinidazol es un derivado del 5-nitroimidazol. Posee los efectos

antimicrobianos del Metronidazol y se emplea de forma similar para tratar infecciones protozoarias sensibles al fármaco, así como en el tratamiento y profilaxis de infecciones causadas por bacterias anaerobias. También se emplea en pautas terapéuticas para la erradicación de *Helicobacter pylori* en la úlcera péptica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Altera el ADN de gérmenes sensibles e impide su síntesis. (Martindale, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** absorbido rápidamente y casi por completo después de dosis orales. (Martindale, 2009).
- **Tiempo en alcanzar la concentración máxima:** 40 microgramos / ml se alcanzó 2 horas después de una sola dosis de 2 g, cayendo a cerca de 10 microgramos / ml a las 24 horas y 2.5 microgramos / ml a las 48 horas. (Martindale, 2009).

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



- **Distribución:** El Tinidazol se distribuye ampliamente y concentraciones similares a las del plasma se han logrado en la bilis, la leche materna, LCR, saliva, y una variedad de tejidos del cuerpo; cruza la placenta fácilmente. (Martindale, 2009).
- **Unión a proteínas:** Sólo el 12% se informa que se une a proteínas plasmáticas. (Martindale, 2009).
- **Vida media:** vida media de eliminación de Tinidazol es de 12 a 14 horas. (Martindale, 2009).
- **Eliminación:** Fármaco inalterado y sus metabolitos se excretan en la orina y, en menor medida, en las heces. (Martindale, 2009).

DOSIS:

ORAL

Adultos:

Amebiasis invasiva: el Tinidazol se administra, generalmente en combinación con un amebicida luminal, en dosis única diaria de 2 g por vía oral, durante 2-3 días. (Martindale, 2009).

Amebiasis hepática: se administra una dosis única diaria de 1.5-2 g durante 3 días o, a veces, hasta 6 días. (Martindale, 2009).

Giardiasis, tricomoniasis, y gingivitis necrotizante ulcerativa aguda: Una dosis única de Tinidazol de 2 g se administra por vía oral. (Martindale, 2009).

Tricomoniasis venérea: los miembros de la pareja deberán recibir tratamiento de forma simultánea. (Martindale, 2009).

Vaginosis bacteriana: se administra una dosis única de 2 g, aunque se consiguen mejores resultados con una dosis de 2 g durante 2 días consecutivos. (Martindale, 2009).

Para el tratamiento de la mayoría de infecciones causadas por bacterias anaerobias, el Tinidazol se administra de forma oral, en general durante 5-6 días, en una dosis inicial de 2 g seguida de una dosis de 1 g diario o 500 mg 2 veces al día.

Para la prevención de infecciones postoperatorias causadas por bacterias anaerobias, se administra 2 g por vía oral, aproximadamente 12 horas antes de la intervención.

En pautas de tratamiento de úlcera péptica, se administra 500 mg de Tinidazol 2 veces al día, junto con Claritromicina y Omeprazol durante 7 días. (Martindale, 2009).

Niños:

Amebiasis invasiva y hepática: En niños se administra 50-60 mg/Kg durante 3-5 días, respectivamente. (Martindale, 2009).

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Giardiasis, tricomoniasis, y gingivitis necrotizante ulcerativa aguda: en niños una dosis única de 50 a 75 mg/Kg para el tratamiento de la giardiasis o la tricomoniasis. Algunas veces puede ser necesario repetir la dosis. (Martindale, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

El Tinidazol atraviesa fácilmente la barrera placentaria y se distribuye en la leche materna. Los fabricantes recomiendan que no se administre durante el primer trimestre del embarazo, ya que se desconocen sus efectos sobre el desarrollo fetal; tampoco debe administrarse a madres durante la lactancia. (Martindale, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

La reacción con el alcohol del Tinidazol, al igual que el Metronidazol, es de tipo disulfiram. (Martindale, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central: También se ha descrito debilidad, mareo, ataxia, cefalea, somnolencia, insomnio y cambios del estado de ánimo o el estado mental como depresión o confusión. La neuropatía periférica, que suele presentarse en forma de

entumecimiento u hormigueo en las extremidades, y las convulsiones epileptiformes, todos estos síntomas son asociados a dosis elevadas o tratamientos prolongados. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: De forma ocasional se observan erupciones cutáneas, urticaria y prurito, y se han descrito raras veces eritema multiforme, angiodema y anafilaxia. (Martindale, 2009).

Gastrointestinales: especialmente náuseas y un gusto metálico desagradable. También se producen vómitos y diarrea o estreñimiento. (Martindale, 2009).

Genitourinarias: malestar uretral y color oscuro de la orina. (Martindale, 2009).

Hepáticas: Se han descrito ocasionalmente unos valores de las enzimas hepáticas elevadas, hepatitis colestásica e ictericia. (Martindale, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Embarazo: está contraindicado en el primer trimestre de embarazo, sopesar riesgo/beneficio en los siguientes meses.
- Lactancia: aparece en leche materna, por eso está contraindicado durante el período de lactancia.

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación: No se han informado casos de sobredosificación.

Tratamiento para la intoxicación: No hay antidotos específicos para el tratamiento de sobredosificación con Tinidazol. El tratamiento es sintomático y medidas de apoyo. El lavado gástrico puede ser de utilidad. El tinidazol es fácilmente dializable.

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 848-849.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 848.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1318-1319.



TIOCONAZOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Tioconazol.

FORMA FARMACEUTICA:

Crema tópica.
Supositorios vaginales.

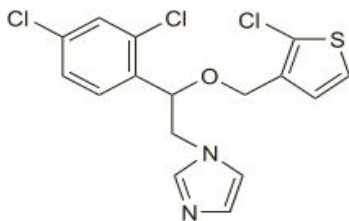
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

1-[2,4-dicloro-β-[(2-cloro-3-tenil)oxi]fenetil]imidazol;
Tioconazol.(Martidale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antifúngico.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tioconazol es un antifúngicoimidazol con un amplio espectro de

actividad, incluyendo la acción contra dermatofitos, Malasseziafurfur, y Candidaalbicans. Tioconazol es activo in vitro frente a algunas bacterias Gram-positivas. Usado en el tratamiento de candidiasis superficial, y la dermatofitosis y pitiriasis versicolor. Para la candidiasis vaginal se utiliza como supositorios vaginales o ungüentospor lo general como una única dosis. Se ha utilizado como una crema tópica 1%, loción o polvo en el tratamiento de infecciones fúngicas superficiales. Tioconazol también se han utilizado para infecciones de las uñas como un 28% w / w de solución tópica, aunque tratamiento sistémico se prefiere generalmente. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: puede ser fungicida, dependiendo de la concentración; inhibe la biosíntesis de Ergosterolu otros esterole mediante el bloqueo de C-14 desmetilación, dañando la membrana de la pared celular fúngica y alterando su permeabilidad, y como resultado, la pérdida de elementos esenciales intracelulares es lo que puede ocurrir.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

FARMACOCINÉTICA:

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



- **Absorción:** Tioconazol no es detectable en plasma después de aplicaciones repetitivas de crema Tioconazolal 2% a uno o varios sitios superficiales que poseen infección por hongos en la piel a través de 28 días de tratamiento (límite de detección de 100 microgramos por litro [mcg/ L]). Concentraciones en plasma de menos de 10 mcg / L se produjo después de aplicar crema de Tioconazolal 2% a una dosis nominal de 40 mg por día se aplicó a la piel del abdomen de sujetos normales durante 14 días.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Tiempo en alcanzar la concentración máxima:** 5,2 y 8 horas, después de la aplicación vaginal de un solo ovulo de 300 mg o una dosis única de pomada al 6.5% respectivamente.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Concentración sérica máxima:** 24,7mcg / L y 18 mcg / L, después de la aplicación vaginal de un solo ovulo de 300 mg o una dosis única de pomada al 6.5%, respectivamente.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS:

Información sobre la dosificación general: para reducir la posibilidad de recurrencia, las infecciones por candida y tineacorporis deben ser

tratados durante 2 a 4 semanas, tineacuris deben ser tratados por hasta 2 semanas, tineapedis, deben ser tratados durante 6 semanas, y la tiña versicolor deben ser tratados por 1 a 4 semanas.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS TÓPICA (TIOCONAZOL EN CREMA):

Adolescentes o Adultos:

Candidiasis cutanea, o tineacorporis: tópica, sobre la piel dos veces al día, mañana y tarde, para 2 a 4 semanas.

Tineacuris: los tópicos, a la piel dos veces al día, mañana y tarde, para un máximo de 14 días.

Tineapedis: tópicos, en la piel dos veces al día, mañana y tarde, por hasta 6 semanas.

Tineaversicolor: tópica, sobre la piel dos veces al día, mañana y tarde, durante 7 a 28 días.

Nota: para la infección en las zonas intertriginosas, crema Tioconazol deben aplicarse con moderación y se alisa en el pozo para evitar los efectos maceración.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Niños:

Para niños de 2 a 12 años de edad: ver la dosis de un adolescente o adulto.



Para niños de hasta 2 años de edad: La dosis no ha sido establecida. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS SUPOSITORIOS VAGINALES:

Adultos:

Antifúngico (vaginal): intravaginal, 300 mg, como una sola dosis, preferiblemente al acostarse. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: Los datos sugieren como límite una segunda dosis una o dos semanas después, puede ser eficaz para aquellos pacientes con síntomas residuales después de una dosis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Niños: niños hasta 12 años de edad la seguridad y eficacia no han sido establecidas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Precauciones: durante el uso de este medicamento consultar con el médico si la condición empeora o si no mejora en: 2 semanas para la tineacrisis; 2 a 4 semanas para la candidiasis cutánea o tineacorporis; de 1 a 4 semanas para la tineaversicolor, 6 semanas para la tineapedis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Utilizando las medidas de higiene para ayudar a curar la infección o para ayudar a prevenir la reinfección:

Para la tinea inguinal: evitar ropa interior ajustada o hecha con materiales sintéticos, en su lugar usar ropa interior suelta de algodón. Si usa un polvo suave y absorbente o polvo antimicótico para la piel, no usar la crema y el polvo de forma simultánea. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para la tinea pedis: secando cuidadosamente los pies, especialmente entre los dedos de los pies, después del baño, evitando los calcetines de lana o de materiales sintéticos, usar medias limpias de algodón y cambiarlos a diario o con más frecuencia si los pies transpiran en exceso. El uso de zapatos o sandalias bien ventilados, si usa un polvo suave y absorbente o un polvo antifúngico entre los dedos de los pies, en los pies, y en los calcetines y los zapatos una o dos veces al día, no usar la crema y el polvo de forma simultánea. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Debido a que la absorción del Tioconazol es despreciable tras su aplicación tópica, no se han comunicado interacciones de este fármaco con otros medicamentos.



INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

EFFECTOS ADVERSOS:

Las reacciones locales al Tioconazol incluyendo ardor, picazón y eritema entre las que han sido reportadas. Preparaciones intravaginales de Tioconazol puede dañar los anticonceptivos de látex y medidas anticonceptivas adicionales. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Embarazo: no se ha demostrado su inocuidad durante el embarazo, al menos durante el primer trimestre del embarazo, solamente se utilizara cuando la valoración riesgo/beneficio aconseje su uso. (Taketomo, 2011).
- Evitar el contacto con los ojos. (Taketomo, 2011).
- Lavar y secar minuciosamente la zona a tratar. (Taketomo, 2011).
- No utilizar vendajes oclusivos o que no dejen transpirar, ya que podrían favorecer el desarrollo de levaduras y la consiguiente irritación cutánea. (Taketomo, 2011).

Si se administran dosis por la vía indicada, no se describen casos de intoxicación.

Tratamiento para la intoxicación: en caso de ingestión accidental, acudir inmediatamente a un centro de atención, donde se tratará la posible irritación gastrointestinal y/o depresión del sistema nervioso central.

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 337, 2865-2867.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 548.



TIOMERSAL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

tiosalicilato y
etilmercurio.(Martindale, 2009).

Tiomersal.

Tiomersal 0,001 a 0,01%, se utiliza como conservante en productos farmacéuticos y biológicos. También se ha utilizado para preservar Las soluciones usadas en el cuidado de lentes de contacto.(Martindale, 2009).

FORMA FARMACEUTICA:

Tintura tópica.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Mercurotiolate, mercurotiolate sódico, etilmercuritolate de sodio, timerosal. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: la acción antibacterial resulta de la liberación de etilmercurio desglosándose en tiosalicilato y etilmercurio.(Martindale, 2009).

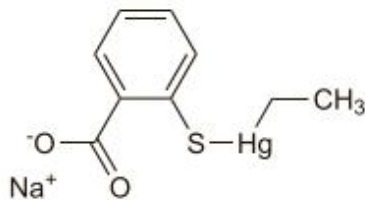
CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antiséptico, bacteriostático y fungicida.(Martindale, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- Distribución:** su distribución es muy amplia.

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Se ha aplicado tópicamente por lo general en una concentración de 0,1%. Su acción antibacteriana de la liberación de etilmercurio después de la destrucción de

DOSIS:

DOSIS TOPICA:

Aplicar localmente 1 a 3 veces al día, según indicación médica. Dejar secar antes de cubrir la piel con vendajes.



CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Este producto no puede ser aplicado a personas con hipersensibilidad a los radicales tio

o mercuriales, ya que pueden presentarse erupciones (máculas, pápulas y vesículas). No aplicar sobre las mucosas.

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Mercromina: Con otros derivados orgánicos mercuriales, ya que este compuesto genera interacción.

Piroxicam: Con el analgésico Piroxicam, por su componente tiosalicílico.

Nota: No debe usarse en combinación con, ni después de la aplicación de ácidos, sales de metales pesados, yodo cuando la piel tratada pudiera tener contacto con aluminio.

EFFECTOS ADVERSOS:

Las reacciones de hipersensibilidad ocurren ocasionalmente. La conjuntivitis alérgica se ha informado.

La mayoría de las reacciones son locales y leves.(Martindale, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Después de su aplicación debe dejarse secar antes de colocar algún tipo de vendaje.

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

La intoxicación con Tiomersal ocurre cuando se ingieren grandes cantidades de la sustancia o éstas entran en el contacto con la piel. La intoxicación también puede ocurrir si uno constantemente se expone a cantidades pequeñas de Tiomersal por un período de tiempo prolongado, para lo cual debe consultar a su médico para que le indique el tratamiento a seguir en base a los efectos que presenta.

En caso de ingerir accidentalmente comuníquese con el centro de control toxicológico más cercano, o a un centro asistencial

REFERENCIAS:

1. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1663-1664.



TIOPENTAL SÓDICO

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Tiopental sódico.

FORMA FARMACEUTICA:

Polvo para uso parenteral.

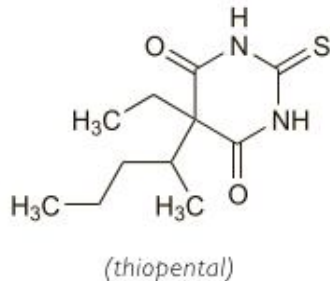
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Tiopental, tiopental sódico. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Anestésico general,
anticonvulsivante barbitúrico;
Barbitúrico. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

El tiopental vía parenteral está indicado en el tratamiento de la hipertensión cerebral, por narcoanálisis en el tratamiento de trastornos psiquiátricos, en el tratamiento de la isquemia cerebral y la hipoxia, y para controlar el estado convulsivo durante o

después de la anestesia por inhalación, anestesia local, u otras causas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

El tiopental es un barbitúrico, anestésico de acción corta.

Se administra por vía intravenosa, por lo general para la inducción de general anestesia, pero puede utilizarse como el único anestésico para mantener la anestesia para procedimientos cortos con un mínimo de estímulos dolorosos. También se utiliza en anestesia como un suplemento a los anestésicos y otros como hipnótico en la anestesia equilibrada. El tiopental sódico también se puede utilizar por vía intravenosa en el control refractario tónico-clónicas, estado del mal epiléptico y en neurocirugía en pacientes para reducir la presión intracraneal. (Martindale, 2009).

Además de su uso como inductor en la anestesia general también se utiliza en el control de estados convulsivos. (Lacy, 2011).

El tiopental no suele producir excitación y la inducción de la anestesia suele ser suave. Tiene pobres propiedades relajantes musculares y un relajante muscular debe darse antes de intentar la intubación. El tiopental también tiene pobres propiedades



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



analgésicas y pequeñas dosis puede incluso reducir el umbral de dolor. La recuperación de la moderada dosis generalmente ocurre dentro de 10 a 30 minutos, pero el paciente puede permanecer somnoliento o confuso por varias horas. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: barbitúrico de acción breve, con propiedades, sedantes, hipnóticas y anticonvulsivas. Los barbitúricos deprimen la corteza sensorial, disminuyen la actividad motora, alteran la función cerebelosa y producen mareo, sedación e hipnosis. A altas dosis los barbitúricos tienen actividad anticonvulsiva; producen depresión respiratoria, dependiente de la dosis. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** El tiopental es altamente soluble en lípidos y cuando se da por vía intravenosa como la sal de sodio, las concentraciones suficientes para producir inconsciencia se consiguen en el cerebro en 30 segundos. (Martindale, 2009).
- **Distribución:** Vd: aproximadamente 1.6 L/Kg. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** es una unión fuerte del 72 a 86%. (Drug

Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

- **Vida media:** de eliminación 3 a 11.5 horas; disminuida en niños. (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático, principalmente hasta metabolitos inactivos, pero también se forma pentobarbital. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Eliminación:** renal, sin embargo, la eliminación renal es mínimo debido a la extensa reabsorción tubular renal debido a la alta solubilidad en lípidos de barbitúricos anestésicos. Despacho: 1,6 a 4,3 ml por kg por minuto; se puede aumentar durante el embarazo a término a 286 ml por minuto. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS:

DOSIS IV

Inducción de anestesia:

Lactantes: 5 a 8 mg/Kg

Niños: de 1 a 12 años de edad: 5 a 6 mg/Kg.

Adultos: 3 a 5 mg/Kg. (Lacy, 2011).

Anestesia de mantenimiento:

Niños: 1 mg/Kg, según sea necesario.

Adultos: 25 a 100 mg según sea necesario. (Lacy, 2011).

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Aumento de la presión intracraneal:

Niños y adultos: 1.5 a 5 mg/Kg/dosis; repetir según sea necesario para controlar la presión intracraneal.(Lacy, 2011).

Convulsiones:

Niños: 2 a 5 mg/Kg/dosis; repetir según sea necesario.
Adultos: 75 a 250 mg/dosis; repetir según sea necesario.(Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:hipersensibilidad al tiopental, los barbitúricos o cualquier componente de la formulación; estado asmático; enfermedad cardiovascular grave; porfiria (mixta o intermitente aguda); no se debe administrar por vía intraarterial.(Lacy, 2011).

Precauciones: se puede presentar laringoespasma o broncoespasma; usar con precaución extrema en pacientes con enfermedad reactiva de vías respiratorias (asma o EPOC). Usar con cuidado cuando el efecto hipnótico pueda prolongarse o potenciarse (premedicación excesiva, enfermedad de Addison, disfunción hepática o renal, mixedema, aumento de urea sanguínea, anemia grave o miastenia grave). Hay potencial de dependencia farmacológica, el cese abrupto puede precipitar un síndrome de abstinencia, que

incluye el estado epiléptico en pacientes con epilepsia. No administrar a pacientes con dolor agudo. Tener precaución en aquellos con aneurisma inestables, enfermedad cardiovascular, alteración renal o hepática. Usar con cautela en individuos de edad avanzada, debilitados o en pacientes pediátricos. Puede causar respuestas paradójicas, incluidas la agitación e hiperactividad, en particular en presencia de dolor agudo y en pacientes pediátricos. Los efectos se pueden potenciar con los de otros fármacos sedantes o el etanol. Puede causar depresión respiratoria o hipotensión. Utilizar con precaución en pacientes hemodinámicamente inestables (hipotensión o choque) o aquellos con enfermedades respiratorias. La dosificación repetida o el suministro continuo en solución pueden causar efectos acumulativos. Administrar solo por vía IV.(Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Aumento del efecto y toxicidad: el tiopental puede aumentar las concentraciones y efectos de alcohol (etílico); depresores del SNC; meperidina; diuréticos tiacídicos.(Lacy, 2011).

Las concentraciones y efectos del tiopental pueden aumentarse por inhibidores de la anhidrasa carbónica, cloranfenicol; divalproex; felbamato; primidona; ácido valproico.(Lacy, 2011).

Disminución del efecto: el tiopental puede disminuir las



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



concentraciones y efectos de acetaminofén (paracetamol); betabloqueadores; antagonista de los canales de calcio; cloranfenicol; anticonceptivos (estrógenos); anticonceptivos (progestágenos); corticosteroides (sistémico); ciclosporina; ciclosporina (sistémica); disopiramida; divalproex; doxicilina; etopósido; fosfato de etopósido; lamotrigina; metadona; propafenona; quinidina; tenipósido; derivados de teofilina; antidepresivos tricíclicos; ácido valproico; antagonista de la vitamina K.(Lacy, 2011).

Las concentraciones y efectos de tiopental pueden disminuir por: ketorolaco (sistémico); mefloquina; piridoxina; derivados de rifamicina.(Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: bradicardia, hipotensión, síncope.(Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: somnolencia, letargo, excitación o depresión del SNC, alteración del juicio, efecto de resaca, confusión, agitación, mareo, hipercinesia, ataxia, nerviosismo, cefalea, insomnio, pesadillas, alucinaciones, ansiedad, escalofríos.(Lacy, 2011).

Dermatológicas: exantema, dermatitis exfoliativa, síndrome de Stevens-Johnson.(Lacy, 2011).

Gastrointestinales: náusea, vomito, estreñimiento.(Lacy, 2011).

Hematológicas: agranulocitosis, trombocitopenia, anemia megaloblástica, anemia hemolítica inmunitaria (rara).(Lacy, 2011).

Locales: dolor en el sitio de inyección, tromboflebitis con el uso de IV.(Lacy, 2011).

Renales: oliguria.(Lacy, 2011).

Respiratorias: laringoespasmos, depresión respiratoria, apnea (en especial con el uso IV rápido), hipoventilación, estornudos, tos, broncoespasmo.(Lacy, 2011).

Misceláneo: gangrena con la inyección intraarterial inadvertida, anafilaxia, reacciones anafilácticas.(Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: C.(Lacy, 2011).
- El tiopental cambia de una farmacocinética lineal a una no lineal después de su administración continua y prolongada en solución.(Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Sobredosis aguda: depresión del SNC, severa; hipotensión, severa; pérdida de la resistencia vascular periférica, depresión respiratoria, grave, incluyendo apnea.

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos

CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Nota: La sobredosis puede resultar de inyecciones demasiado rápidas o repetidas de anestésicos barbitúricos. Depresión circulatoria y respiratoria puede resultar en edema pulmonar y / o paro cardiorrespiratoria.

Tratamiento de la sobredosis: interrupción de la anestesia.

Vigilancia: los signos vitales, gases sanguíneos y electrolitos séricos deben ser monitoreados.

Atención de apoyo: las medidas de apoyo tales como establecer y mantener una vía aérea permeable (intubación endotraqueal por si es necesario), la administración de oxígeno al 100% con ventilación asistida si es necesario. Para la hipotensión, fluidos intravenosos y levantar las piernas del paciente, si un aumento deseable de la presión arterial no se obtiene, fármacos vasopresores y / o inotrópico se pueden utilizar según sea necesario.¹

3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1795-1796.

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 178-185.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp. Pp. 1636-1637.

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenett.com

www.cegimed.org



TIORIDAZINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Tioridazina.

FORMA FARMACEUTICA:

Comprimido recubierto.

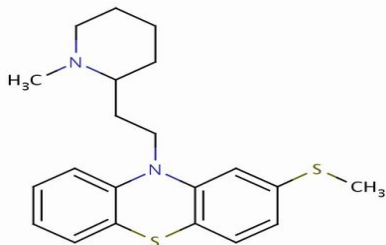
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Clorhidrato de tioridazina. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antipsicótico típico, fenotiacínico. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tioridazina es una Fenotiazina con propiedades generales similares a los de la Clorpromazina. Tiene una Piperidinade cadena lateral y, a diferencia de Clorpromazina, tiene poca actividad antiemética. El uso de Tioridazina se ha restringido al tratamiento de la esquizofrenia en los pacientes

que no muestran una adecuada la respuesta al tratamiento con otros antipsicóticos. Su uso en otros trastornos psiquiátricos fue abandonado después de que se consideró que no existía un equilibrio aceptable entre riesgos y beneficios como resultado de su potencial cardiotoxico. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: la Tioridazina es una FenotiazinaPiperidínica que bloquea los receptores dopaminérgicosmesolímbicospostsinápticos en el cerebro; muestra un efecto de bloqueador alfa adrenérgico fuerte y deprime la secreción de hormonas hipotalámicas e hipofisarias. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** La absorción puede ser irregular y las concentraciones plasmáticas máximas muestran grandes diferencias interindividuales, posiblemente debido a las grandes diferencias interindividuales en la medida de metabolismo de primer paso. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



- **Distribución:** Fenotiazinas tienen un gran volumen de distribución, atraviesa fácilmente la placenta y se distribuye en la leche materna.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Unión a proteínas:** la unión a proteínas es muy alta alrededor del 90% o más.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Vida media:** 21 a 25 horas.(Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático a metabolitos activos e inactivos, ya que la administración parenteral evita metabolismo de primer paso, las proporciones de sus metabolitos, que se presenta en la circulación pueden diferir con diferentes vías de administración. dependiendo de las contribuciones de la droga madre y cada uno de metabolitos de la eficacia y / o efectos adversos, estas diferencias en la proporción puede dar lugar a diferencias en los efectos, lo que lleva al paciente a experimentar las formas de dosificación oral y parenteral de la misma medicación de manera diferente. citocromo P450 2D6 (CYP2D6) ha demostrado ser involucrado en el metabolismo de la tioridazina.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:**

aproximadamente
h.(Lacy, 2011).

1

- **Eliminación:** renal y biliar, con un poco de reciclado enterohepático.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS:

DOSIS ORAL

Adultos:

Esquizofrenia/psicosis: inicial 50 a 100 mg 3 veces/día con incrementos graduales, según se requiera y tolere; máximo: 800 mg/día en 2 a 4 dosis divididas.(Lacy, 2011).

Nota: Trastornos en niños y ancianos su uso no es autorizado.(Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: Depresión grave del sistema nervioso central; enfermedad hipertensora o hipotensora grave; coma; en combinación con otros fármacos que se sabe prolongan el intervalo QT_c y/o inhibidores de CYP2D6; en pacientes con síndrome de QT largo congénito o antecedente de arritmias cardiacas; uso concomitante con medicamentos que inhiben el metabolismo de la Tioridazina (Fluoxetina, Paroxetina, Fluvoxamina, Propranolol, Pindolol); pacientes que se sabe tienen un defecto congénito que lleva a cifras



menores de actividad de CYP2D6.(Lacy, 2011).

Para todos los pacientes que comienzan Tioridazina se recomienda que una ECG basal y la detección de electrolitos se lleven a cabo. Un ECG también se debe repetir antes de cada aumento de la dosis una semana después que la dosis terapéutica máxima se ha alcanzado, y mensualmente a los 6 intervalos en los que continua el tratamiento.(Martindale, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante de la Tioridazina con cualquiera de los siguientes: Arteméter, inhibidores de CYP2D6; Dronedarona; Fluvoxamina; Lumefantrina; Metoclopramida; Nilotinib; Pimozida; agentes que prolongan el QT_c; Quinidina; Tetrabenazina; Ziprasidona.(Lacy, 2011).

Aumento del efecto/toxicidad: la Tioridazina puede aumentar las concentraciones y efectos de: alcohol (etílico); analgésicos (opioides); anticolinérgicos; agentes contra el parkinson (agonistas de dopamina); betabloqueadores; depresores del SNC; sustratos de CYP2D6; Dronedarona; Fesoterodina; Pimozida; agentes que prolongan el QT_c; Quinidina; Tamoxifeno; Tetrabenazina; Ziprasidona.(Lacy, 2011).

Las concentraciones y efectos de la tioridazina pueden aumentar por: inhibidores de la acetilcolinesterasa

(centrales); Alfuzosina; agentes antipalúdicos; Arteméter; betabloqueadores; Cloroquina; Ciprofloxacino; Ciprofloxacino (sistémico); inhibidores de CYP2D6; Darunavir; Fluvoxamina; Gadobutrol; fórmulas de litio; lumefantrina; Metoclopramida; nilotinib; Pramlintida; agentes que prolongan el QT_c; Quinina; Tetrabenazina.(Lacy, 2011).

Disminución del efecto: Tioridazina puede disminuir las concentraciones de: anfetaminas; tramadol.(Lacy, 2011).

Las concentraciones y efectos de la Tioridazina pueden disminuir por: antiácidos; agentes contra el parkinson (agonistas de dopamina); fórmulas con litio; peginterferón alfa_{2b}.(Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: hipotensión, hipotensión ortostática, edema periférico, cambios del ECG.(Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: EPS (seudoparkinsonismo, acatisia, distonías, discinesia tardía), mareo, somnolencia, síndrome neuroléptico maligno (NMS), alteración de la regulación de la temperatura, disminución del umbral de convulsiones.(Lacy, 2011).

Dermatológicas: aumento de la sensibilidad al sol, exantema,



decoloración de la piel (azul-gris).(Lacy, 2011).

Endocrinas y metabólicas: cambios en el ciclo menstrual, en la libido, dolor mamario, galactorrea, amenorrea.(Lacy, 2011).

Gastrointestinales: estreñimiento, aumento de peso, náusea, vómito, dolor gástrico, xerostomía, diarrea.(Lacy, 2011).

Genitourinarias: dificultad miccional, trastornos eyaculatorios, retención urinaria, priapismo.(Lacy, 2011).

Hematológicas: agranulocitosis, leucopenia.(Lacy, 2011).

Hepáticas: ictericia colestática, hepatotoxicidad.(Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: escalofríos con temblor, convulsiones.(Lacy, 2011).

Oculares: retinopatía pigmentaria, visión borrosa, cambios de córnea y cristalino.(Lacy, 2011).

Respiratorias: congestión nasal.(Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo:C.(Lacy, 2011).
- Lactancia:se desconoce su excreción en la leche materna, no se recomienda.(Martindale, 2009).

- Medicamentos que corresponde a los criterios de Beers: este fármaco puede ser inapropiado para usarse en pacientes Geriátricos (riesgo alto de gravedad).(Martindale, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Efectos clínicos de la sobredosis:

Nota: los rangos de concentración tóxicos de la sangre no se han establecido para las fenotiazinas. Sin embargo, para Tioridazina, la toxicidad puede comenzar en una concentración en sangre de 1 mg / dl y el rango de concentración letal se piensa que es 2 a 8mg/dL. Los siguientes efectos han sido seleccionados sobre la base de su potencial significancia clínica (signos y síntomas en los mejores elementos entre paréntesis en su caso) no necesariamente inclusiva

Síntomas agudos: arreflexia o hiperreflexia (pérdida o aumento de los reflejos), visión borrosa, la toxicidad cardíaca, incluyendo arritmia cardíaca, paro cardíaco, insuficiencia cardíaca congestiva, hipotensión, shock, taquicardia, cambios QRS, o la fibrilación ventricular (desmayos, rápido, latidos del corazón lentos o irregulares, dificultad para respirar, cansancio o debilidad inusual); toxicidad del SNC, incluyendo agitación, confusión, convulsiones, puede ser seguido por la depresión respiratoria, desorientación, somnolencia, estupor o coma, pupilas dilatadas, sequedad de



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



boca, hipertermia (fiebre); o hipotermia (torpeza, confusión, somnolencia, debilidad muscular, temblor), rigidez muscular, edema pulmonar o depresión respiratoria (dificultad para respirar), vómitos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento para la intoxicación: el tratamiento es esencialmente sintomático y de soporte. Para disminuir la absorción: intentar un lavado gástrico temprano, evitando la inducción del vómito porque el potencial de Fenotiazina inducida por alteración de la conciencia o reacciones distónicas de la cabeza y el cuello puede dar lugar a la inspiración de vómito. Administrar suspensión de carbón activado en varias ocasiones. La administración de catártico salino, sobre todo si la dosificación que se ha ingerido es de liberación prolongada. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento específico: el control de las arritmias cardíacas con Fenitoína por vía intravenosa, de 9 a 11 mg por Kg de peso corporal (mg /Kg). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007). Digitalización para la insuficiencia cardíaca.

Tratamiento de la hipotensión con líquidos intravenosos y vasopresores como la norepinefrina o Fenilefrina (sin utilizar un vasopresormezclado con algún compuesto que presente actividad agonista alfa y beta, como la adrenalina, ya que puede causar

hipotensión paradójica debido al bloqueo alfa por Fenotiazina). Controlar las convulsiones con Diazepam seguido de Fenitoína, mientras se lleva a cabo la monitorización del ECG, evitar los barbitúricos, ya que puede potenciar depresión las vías respiratorias y del SNC. La administración de Benzotropina o Difenhidramina para gestionar los efectos agudos de Parkinson que pueden ocurrir. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Vigilancia:

- Monitorización de la función del SNC.
- Monitorización de la función cardiovascular, por no menos de 5 días. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Cuidados de apoyo:

- El mantenimiento de la función respiratoria, incluyendo aspiración faríngea y traqueal para eliminar el exceso de mucosidad, si es necesario.
- Mantener la temperatura corporal. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Pacientes en los que se ha confirmado o se sospecha una sobredosis intencional deben ser referidos para consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Nota: la diálisis de Fenotiazinas no ha tenido éxito. Si la forma de dosificación que se ha ingerido es de liberación prolongada, el tratamiento debe, continuar por el tiempo que los signos y síntomas de sobredosis permanecen.

El paciente no puede mostrar la excitación para un máximo de 48 horas, incluso cuando las medidas de apoyo y para contrarrestar seesten empleando. Fenotiazinas son radiopacos y las tabletas ingeridas pueden verse en radiografía.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2393-2415.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp.Pp. 1637-1639.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1031-1032.



TOBRAMICINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Tobramicina.

FORMA FARMACEUTICA:

Solución Oftálmica.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Nombre Químico:

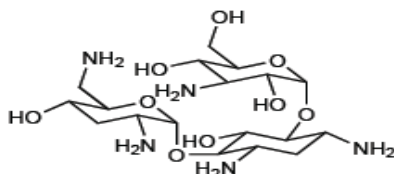
0-3-amino-3 desoxi-a-glucopiranosil-(1-4)-0-(2,6-dimino-2,3,6-tridesoxi-a-D-ribo-hexanopiranosil-(1-6))-2-desoxi-L-estreptamina. (Martindale, 2009).

Sinónimos: Sulfato de Tobramicina. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antibacterial (oftálmico). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

ACEPTADO:

Tratamiento de infecciones oculares: está indicado en el tratamiento de infecciones oculares externas causadas por organismos susceptibles. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

NO

ACEPTADO:

no es eficaz contra la mayoría de las cepas de estreptococos del grupo D. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

Activamente transportados a través de la membrana celular bacteriana, Tobramicina se une a una proteína receptora específica sobre la subunidad 30S de los ribosomas bacterianos e interfiere con un complejo de iniciación entre el ARN mensajero (ARNm) y la subunidad 30S, la síntesis de proteínas inhibiendo así. La secuencia de bases del ARNm puede ser malinterpretado, por lo tanto la producción de proteínas no funcionales. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción**

Puede ser absorbido en cantidades mínimas después de la aplicación tópica en el ojo. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS:

Oftálmica:

- **Niños \geq 2 meses y adultos:**

Solución: instilar 1 a 2 gotas cada 2 a 4 h; para infecciones graves, instilar hasta 2 gotas cada hora hasta observar mejoría, después disminuir a intervalos menos frecuentes. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la Tobramicina o cualquiera de los componentes de la fórmula. (Lacy, 2011).

Las consideraciones médicas y contraindicaciones incluidas han sido seleccionadas sobre la base de su importancia clínica potencial. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Riesgo-beneficio debe ser considerado cuando los siguientes

problemas médicos existen: sensibilidad a la tobramicina. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Precauciones: los factores de riesgo usuales incluyen disfunción renal previa, uso concomitante de medicamentos neuro/nefrotóxicos, edad avanzada y deshidratación. La ototoxicidad puede ser directamente proporcional a la cantidad de fármaco administrada y la duración del tratamiento; los acúfenos o el vértigo son índices de daño vestibular y de pérdida inminente de la audición; el daño renal suele ser reversible. Puede causar bloqueo neuromuscular y parálisis respiratoria, en especial cuando se administra poco después de la anestesia o de relajantes musculares. (Lacy, 2011).

No se pretende para el tratamiento a largo plazo por los riesgos tóxicos vinculados con su administración prolongada; tener precaución en presencia de insuficiencia renal previa, alteración vestibular o coclear, miastenia grave, hipocalcemia y circunstancias que disminuyen la transmisión neuromuscular. Se requiere modificación de la dosis en pacientes con alteración de la función renal. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

- Si la Tobramicina oftálmica tópica se administra cuando el paciente está recibiendo un antibiótico



aminoglucósido sistémico, la concentración total en suero del paciente debe ser controlado. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Nota: la Tobramicina oftálmica debe interrumpirse si se presentan reacciones de hipersensibilidad. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

El uso prolongado de agentes anti-infecciosos puede resultar en el crecimiento de organismos no susceptibles como hongos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Aquellos que indican necesidad de atención médica:
Incidencia menos frecuente:
Hipersensibilidad (prurito, enrojecimiento, hinchazón u otra señal de irritación de los ojos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **B.**²

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un Centro de Control de

Envenenamientos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Síntomas de sobredosis: aumento de riesgo de los ojos, picazón, enrojecimiento o hinchazón de los ojos o los párpados; queratitis punteada (irritación dolorosa de la parte frontal transparente del ojo). (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2872, 2873.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1649-1650.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 354.

TOPIRAMATO

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Topiramato.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

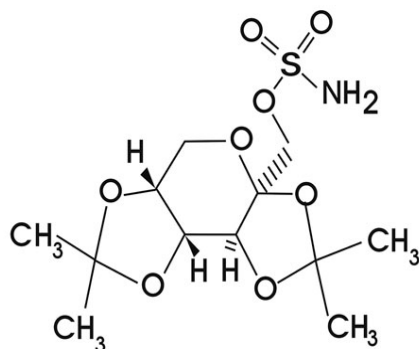
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Topiramato, Sulfamato de 2,3:4,5-di-O-(1-isopropilideno)-B-D fructopiranosas. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Anticonvulsivante, diversos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Monoterapia inicial de convulsiones tonicoclónicas o convulsiones de inicio parcial (autorizado por la FDA para ≥ 10 años). (Taketomo, 2009).

Tratamiento adyuvante de convulsiones tonicoclónicas generalizadas primarias o convulsiones de inicio parcial (autorizado por la FDA para ≥ 2 años). (Taketomo, 2009).

Terapéutica adyuvante de convulsiones relacionadas con síndrome de Lennox-Gastaut (autorizado por la FDA para ≥ 2 años). (Taketomo, 2009).

Profilaxia de la cefalera migrañosa (autorizado por la FDA para adultos); puede ser útil en espasmos infantiles. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción:

Su mecanismo de acción exacto de acción se desconoce; es posible que su eficacia profiláctica en epilepsia y migraña se deba a bloqueo de canales de sodio dependientes de voltaje, potenciación del Ácido Gammaaminobutírico (GABA, un neurotransmisor inhibitorio) y



antagonismo de la activación de los receptores subtipo glutamato (un aminoácido excitador) por el Kainato; también inhibe la anhidrasa carbónica (efecto menor). (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** rápida. (Taketomo, 2009).
- **Distribución:** se distribuye extensamente en la leche materna. (Taketomo, 2009).
- **V_d adultos:** 0.6 a 0.8 L/Kg. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:** 15 a 41%; el porcentaje disminuye conforme los niveles en sangre aumentan. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** cantidades pequeñas se metabolizan en el hígado por hidroxilación, hidrólisis y glucuronidación; el porcentaje de la dosis que se metaboliza en el hígado y su depuración es mayor en pacientes que reciben inductores enzimáticos. (Taketomo, 2009).
- **Biodisponibilidad:** tabletas: 80% (en comparación con una solución preparada). (Taketomo, 2009).
- **Vida media:**
Adultos: 19 a 23 h (promedio: 21 h)

- **Adultos con distribución renal:** 59 ± 11 h ($n = 7$). (Taketomo, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** 2 h; intervalo: 1.4 a 4.3 h. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** 70% de la dosis se excreta sin cambios en la orina; puede sufrir reabsorción tubular renal. (Taketomo, 2009).
- **Depuración:**
 - Niños de 4 a 17 años: 50% más que en adultos (por peso).
 - Adultos: 20 a 30 mL/min
 - Disfunción renal: reducida
 - Disfunción hepática: puede estar reducida.
- **Diálisis:** se hemodializa de manera significativa; depuración por diálisis: 120 mL/min (cuatro a seis veces mayor que en adultos con función renal normal); pueden requerirse dosis complementarias. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Oral:

Anticonvulsivante, terapéutica adyuvante:

Niños de 2 a 16 años: -Crisis de inicio parcial o síndrome de Lennox-Gastaut:



Inicial: 1 a 3 mg/Kg/día (máximo: 25 m) administrados en la noche durante una semana; aumentar 1 a 3 mg/kg/día divididos en dos dosis a intervalos de una a dos semanas; ajustar la dosis de acuerdo con la respuesta; mantenimiento usual: 5 a 9 mg/kg/día divididos en dos dosis. (Taketomo, 2009).

Convulsiones tónico-clónicas generalizadas primarias: usar la dosis inicial como se mencionó arriba, pero ajustar más lentamente; hasta 6 mg/kg/día hacia el final de ocho semanas. (Taketomo, 2009).

Adolescentes > 17 años y adultos:

-Crisis de inicio parcial:

Inicial: 25 a 50 mg/día a diario por una semana; incrementar a intervalos semanales en 25 a 50 mg/día divididos en dos dosis; ajustar la dosis de acuerdo con la respuesta; mantenimiento usual: 100 a 200 mg dos veces al día; dosis máxima: 1600 mg/día. (Taketomo, 2009).

Crisis tónico-clónicas generalizadas primarias: usar la dosis inicial como se mencionó arriba, pero con una velocidad de ajuste inicial menor, administrar fraccionada en dos dosis; ajustar en forma ascendente hasta la dosis recomendada hacia el final de ocho semanas; mantenimiento usual: 200 mg dos veces al día; dosis máxima: 1600 mg/día. (Taketomo, 2009).

Monoterapia anticonvulsivante:
Convulsiones de inicio parcial o

tónico-clónicas generalizadas primarias:

Niños ≥ 10 años y adultos: inicial: 25 mg dos veces al día; aumentar 50 mg/día a intervalos semanales hasta llegar a una dosis de 100 mg dos veces al día (dosis de la cuarta semana); en lo sucesivo pueden aumentarse 100 mg/día a intervalos semanales, hasta la dosis máxima recomendada de 200 mg dos veces al día. (Taketomo, 2009).

Profilaxia de migraña: adultos: inicial: 25 mg/día; aumentar a intervalos semanales 25 mg/día; administrar dividido en dos dosis; ajustar la dosis con base en la respuesta; dosis usual eficaz: 50 a 100 mg dos veces al día; dosis máxima: 200 mg/día. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad al Topiramato o cualquier componente de la fórmula. (Taketomo, 2009).

Precauciones a considerar:

Se utilizará con precaución en pacientes con alteraciones renales o hepáticas. Se recomienda una hidratación adecuada para reducir el riesgo de desarrollar litiasis renal, en especial en pacientes predispuestos. (Martindale, 2009).

Emplear con precaución en individuos alérgicos a sulfas y con disfunción hepática. El uso concomitante de Ácido Valproico



puede ocasionar hiperamonemia con o sin encefalopatía; utilizar con cuidado en pacientes con errores congénitos del metabolismo o disminución de la actividad mitocondrial hepática. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante: No hay interacciones conocidas por las que se recomienda evitar el uso concomitante. (Lacy, 2011).

Aumento del efecto/toxicidad

Topiramato puede aumentar las concentraciones/efectos de: Alcohol (Etílico); depresores del SNC; Divalproex; Metotrimoprazina; Fenitoína, Ácido Valproico. (Lacy, 2011).

Las concentraciones/efectos del Topiramato pueden aumentar por: Metotrimoprazina. (Lacy, 2011).

Disminución del efecto

Topiramato puede disminuir las concentraciones/efectos de: anticonceptivos (estrógenos); anticonceptivos (progestágenos); Saxagliptina. (Lacy, 2011).

Las concentraciones/efectos del Topiramato pueden disminuir por: Carbamazepina; Ketorolaco; Mefloquina; Fenitoína. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Los efectos adversos asociados al tratamiento con Topiramato consisten en:

Ataxia, deterioro de la concentración, confusión, mareo, fatiga, parestesias, somnolencia y dificultades de memoria o cognición. También se han mencionado agitación, inestabilidad emocional (con trastornos del humor) y depresión. Otros efectos adversos descritos son dolor abdominal, anorexia, astenia, diplopía, leucopenia, náuseas, nistagmo, retraso psicomotor, alteraciones del habla, alteraciones del gusto, alteraciones visuales y pérdida de peso. Es mayor el riesgo de desarrollar litiasis renal, en especial en pacientes predispuestos. (Martindale, 2009).

Efectos sobre los electrolitos: se ha demostrado acidosis metabólica en un hombre al que se prescribió Topiramato como tratamiento complementario para una epilepsia intratable. (Martindale, 2009).

Efectos hepáticos. (Martindale, 2009).

Efectos sobre el sistema nervioso. (Martindale, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C** (Taketomo, 2009).
- Interacción con alimentos: el alimento disminuye su rapidez pero no su grado de absorción;



una dieta cetogénica podría aumentar el riesgo de nefrolitiasis. (Taketomo, 2009).

- Los pacientes que reciben Topiramato pueden presentar acidosis metabólica hiperclorémica. (Taketomo, 2009).
- El Topiramato puede disminuir las concentraciones séricas de bicarbonato por inhibición de anhidrasa carbónica e incremento de la excreción renal de Bicarbonato. (Taketomo, 2009).
- Debe vigilarse el Bicarbonato sérico basal y en forma periódica durante el tratamiento con Topiramato. (Taketomo, 2009).
- No suspender de manera abrupta el tratamiento en pacientes con o sin antecedente de convulsiones; reducir gradualmente para disminuir la probabilidad de que ocurran convulsiones o la frecuencia convulsiva aumente. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Sobredosis:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un Centro de Control de Envenenamientos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento de la sobredosis: si la ingestión es reciente, el estómago debe vaciarse inmediatamente por medio de un lavado o por inducción de emesis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

El Carbón Activado no se recomienda en casos de sobredosis. La hemodiálisis es un medio eficaz para eliminar Topiramato del cuerpo. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Los pacientes en quienes se haya confirmado o se sospecha una sobredosis intencional deben ser referidos para consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2866, 2884, 2885.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 506.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1219-1220



TOXOIDE DIFTERICO Y TOXOIDE TETANICO

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Toxoide diftérico, Toxoide tetánico.

FORMA FARMACEUTICA:

Suspensión inyectable.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

DT; Td; Toxoides tetánico y diftérico. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente de agentes inmunizantes.

Vacuna. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INDICACIONES:

La difteria y el tétanos adsorbidos pueden ser utilizados para la inmunización activa, aunque las vacunas utilizadas para la inmunización primaria por lo general se combinan la difteria, el tétanos y la tos ferina, y en ocasiones también *Haemophilus influenzae* y poliomielitis.³

Toxoides de difteria y tétanos adsorbidos para uso pediátrico (DT):

lactantes y niños hasta de 6 años: inmunidad activa contra difteria y tétanos, y profilaxia de tétanos en la atención de heridas, cuando la fracción *pertussis* está contraindicada. (Taketomo, 2009).

Toxoides de difteria y tétanos adsorbidos para uso en adultos (Td):

niños ≥ 7 años y adultos: inmunidad activa contra difteria y tétanos; profilaxia de tétanos en la atención de heridas. (Taketomo, 2009).

El Advisory Committee on Immunization Practices (ACIP) recomienda la vacunación de rutina para los siguientes:

- Adultos y niños ≥ 7 años deben recibir una dosis de refuerzo de Td cada 10 años; personas < 65 años de edad pueden sustituir una dosis de refuerzo única de Td con Tdap. (Lacy, 2011).
- Niños de 7 a 10 años, adultos y ancianos (≥ 65 años) que se lesionan en explosiones de bombas o eventos masivos con lesiones penetrantes o exposición de piel no intacta, y quienes no pueden confirmar haber recibido una dosis de refuerzo contra tétanos en los 5 años previos, pueden también recibir una dosis única de Td; los



niños ≥ 11 años pueden también recibir Td si no se cuenta con Tdap. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: Después de la inyección intramuscular, toxoide diftérico y toxoide tetánico induce la formación de la antitoxina diftérica y antitoxina tetánica, respectivamente. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS:

IM:

Lactantes y niños ≤ 6 años (DT): inmunización primaria:

- 6 semanas a 1 año: 3 dosis de 0.5 ml por lo menos con 4 semanas de diferencia; administrar 1 dosis de refuerzo 6 a 12 meses después de la tercera inyección. (Lacy, 2011).
- 1 a 6 años: 2 dosis de 0.5 ml con por lo menos 4 a 8 semanas de diferencia; dosis de refuerzo 6 a 12 meses después de la segunda inyección; si la dosis final se aplica después del séptimo año de vida, se debe usar la preparación para adultos. (Lacy, 2011).
- 4 a 6 años (inmunización de refuerzo): 0.5 mL; no se requiere

si la cuarta dosis se administra después del cuarto año de vida; administrar dosis de refuerzo de rutina con intervalos de 10 años con la preparación para adultos. (Lacy, 2011).

Niños ≥ 7 años y adultos (Td):

- Inmunización primaria: los pacientes no inmunizados previamente deben recibir 2 dosis primarias de 0.5 mL cada una, con intervalos de 4 a 8 semanas; la tercera dosis (refuerzo) de 0.5 mL de 6 a 12 meses después. (Lacy, 2011).
- Inmunización de refuerzo: 0.5 mL cada 10 años; para darse a niños de 11 a 12 años de edad si han pasado por lo menos 5 años desde la última dosis de vacuna que contiene el toxoide. No se recomiendan dosis subsecuentes de rutina con mayor frecuencia a 1 cada 10 años. El ACIP (El Advisory Committee on Immunization Practices) prefiere el uso de Tdap en adolescentes de 11 a 18 años. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Toxoide de Difteria, tétanos o cualquier componente de la fórmula. (Taketomo, 2009).

Precauciones a considerar:

Administrar con cautela en pacientes con trombocitopenia o cualquier trastorno de la



coagulación que pueda verse afectado por la inyección IM; si el paciente recibe tratamiento antihemofílico u otro similar, la inyección IM puede programarse para poco después de administrar el tratamiento. No se recomienda la administración profiláctica de Acetaminofén para prevenir la fiebre debido a que existe evidencia de disminución de la respuesta inmunitaria a algunas vacunas con éste fármaco; la relevancia clínica de esta reducción no se ha definido. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante: No se conocen interacciones pro las cuales se recomienda evitar el uso concomitante. (Lacy, 2011).

Aumento del efecto/toxicidad: No se conocen interacciones significativas que involucren un aumento del efecto. (Lacy, 2011).

Disminución del efecto: las concentraciones/efectos de los Toxoides de Difteria y Tétanos pueden disminuir por: inmunosupresores. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

> **10%:** locales: sitio de inyección (19%; incluyendo eritema, induración, dolor). (Taketomo, 2009).

Sistema nervioso central: neuritis braquial, síndrome de Guillain-Barré (raro), mareo, parestesias, convulsiones, fiebre, malestar general, trastornos electroencefalográficos, encefalopatía (rara). (Taketomo, 2009).

Dermatológicos: exantema, urticaria. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: náusea, vómito. (Taketomo, 2009).

Locales: dolor a la palpación, eritema, inflamación o dolor en el sitio de la inyección; absceso estéril; nódulo palpable en el sitio de la inyección. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: artralgias, mialgias. (Taketomo, 2009).

Diversas: reacciones alérgicas o anafilácticas, reacción de hipersensibilidad tipo Arthus. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C** (Taketomo, 2009).
- No confundir Difteria y Tétanos pediátricos (DT) con tétanos y difteria de adultos (Td). (Lacy, 2011).
- Consideraciones durante el embarazo: el Td se debe administrar durante el embarazo en mujeres que no tienen



suficiente inmunidad para proteger contra el tétanos materno y neonatal, y si requieren protección de refuerzo contra difteria (p.ej., viajes a lugares dónde la difteria es endémica). (Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Toxoide Diftérico Sobredosificación.

La aplicación muy frecuente puede causar trastornos de hipersensibilidad muy severos. (Lacy, 2011).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 1235-1236.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1674, 1675.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 2210.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1228.



TRAMADOL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Clorhidrato de Tramadol.

FORMA FARMACEUTICA:

Cápsulas.
Solución Inyectable.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

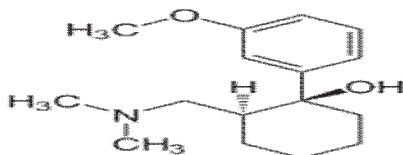
(±)-trans-2-dimetilaminometil-1-(3-metoxifenil) hidrocloreto de ciclohexanol. (Martindale, 2009).

Sinónimos: Hidrocloreto de tramadol, tramadol, clorhidrato de tramadol; clorhidrato de tramadol. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Analgésico no opioide. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Liberación inmediata: alivio de dolor agudo o crónico moderado o intenso, inclusive posoperatorio, por cáncer, neuropático, lumbalgia y dolor relacionado con trastornos ortopédicos (autorizado por la FDA para ≥ 17 años). (Taketomo, 2009).

Liberación prolongada: para pacientes que requieren control constante del dolor moderado o grave durante un periodo largo. (Taketomo, 2009).

Tiene también propiedades noradrenérgicas y serotoninérgicas que pueden contribuir a su actividad analgésica. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: El Tramadol y su metabolito O-desmetil se fijan a receptores opiáceos Y en el SNC y causan inhibición de las vías ascendentes del dolor, lo que altera la percepción y la respuesta al mismo; inhibe la recaptura de Norepinefrina y Serotonina, lo cual modifica la función de la vía ascendente del dolor. (Taketomo, 2009).



FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** rápida y completa. (Taketomo, 2009).
- **Distribución:** atraviesa la barrera placentaria; se excreta en la leche materna
 V_d : 2.5 a 3 L/Kg. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:** 20%. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** principalmente hepático, por desmetilación, glucoronidación y sulfatación. (Taketomo, 2009).
- **Biodisponibilidad:** liberación inmediata: 75%; liberación prolongada: 8 a 95% en comparación con la presentación de liberación inmediata. (Taketomo, 2009).
- **Vida media:** aproximadamente 6 a 8 h. (Taketomo, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** Liberación inmediata: 2 h. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** se excreta en orina como fármaco sin cambio (30%) y metabolitos (60%). (Taketomo, 2009).
- **Diálisis:** < 7% se elimina en un periodo de diálisis de 4 h. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Dosificación usual: oral. (Taketomo, 2009).

Liberación inmediata:

Niños: 1 a 2 mg/kg/dosis cada 4 a 6 h.
Máximo: 400 mg/día

Adolescentes y adultos: 50 a 100 mg cada 4 a 6 h;

Máximo: 400 mg/día

En pacientes que no requieren un inicio rápido del efecto, la tolerancia a los efectos adversos pueden mejorar si la terapéutica se inicia con 25 mg/día y la dosis se ajusta en 25 mg cada tres días hasta llegar a 25 mg cuatro veces/día. Después puede aumentarse la dosis 50 mg cada tres días hasta alcanzar 50 mg cuatro veces/día. (Taketomo, 2009).

Liberación prolongada:

≥ 18 años: 100 mg una vez al día, ajustar en incrementos de 100 mg cada cinco días si es necesario para el alivio del dolor; (Taketomo, 2009).

Máximo: 300 mg/día

≥ 16 años: 100 mg una vez al día; ajustar en incrementos de 100 mg cada dos o tres días si es necesario para el alivio del dolor; (Taketomo, 2009).



Máximo: 300 mg/día. (Taketomo, 2009).

DOSIS HABITUAL EN ADULTOS Y ADOLESCENTES:

TRAMADOL INYECTABLE

Intramuscular, intravenosa (Lenta) e infusión intravenosa, subcutánea. (Taketomo, 2009).

Dosis individual de 1 ampolla: cada 4 horas. (Taketomo, 2009).

Dosis máxima diaria: hasta 4 ampollas. (Taketomo, 2009).

Dosis pediátrica usual:

Niños menores de 16 años: Su seguridad y eficacia aún no se han establecido. (Taketomo, 2009).

Niños mayores de 16 años de edad: Usar dosis usual de adultos y adolescentes. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad al Tramadol, los opioides o cualquier componente de la formulación, pacientes dependientes de opioides; intoxicación aguda por alcohol, hipnóticos, analgésicos de acción central, opioides o fármacos psicotrópicos. (Lacy, 2011).

Precauciones: El Tramadol debe utilizarse con precaución en los pacientes con trastornos renales o hepáticos y su empleo debe evitarse

si la afectación renal es grave. Se ha observado que la eliminación por hemodiálisis es muy lenta. (Martindale, 2009).

El Tramadol debe emplearse con precaución en pacientes con antecedentes de epilepsia o en los propensos a las convulsiones. (Martindale, 2009).

El riesgo de convulsiones puede ser mayor en pacientes que reciben inhibidores selectivos de la recaptura de serotonina (ISRS) o Anorexígenos, Antidepresivos Tricíclicos, Ciclobenzaprina, Inhibidores de la MAO. (Taketomo, 2009).

Usar con cautela y reducir la dosis cuando se administre a pacientes que reciben otros depresores del SNC (puede causar depresión central, depresión respiratoria o ambas cuando se combina con tales fármacos). (Taketomo, 2009).

Evitar la administración a pacientes con tendencia suicidas o propensos a las adicciones. Evitar su uso durante el embarazo (se refieren convulsiones neonatales, síndrome de abstinencia en el recién nacido y muerte fetal). (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Las asociaciones que contengan cualesquiera de las siguientes sustancias, dependiendo de la cantidad presente, pueden presentar interacción:

- Alcohol.



- Agentes Anestésicos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).
- Se ha observado que la Carbamazepina disminuye la acción analgésica del Tramadol al reducir sus concentraciones séricas. (Martindale, 2009).
- Existe la posibilidad de que interaccione con otros fármacos que refuerzan la neurotransmisión monoaminérgica, como el Litio, los Antidepresivos Tricíclicos y los inhibidores selectivos de la recaptación de serotonina. No debe administrarse a los pacientes que estén recibiendo IMAO a los hayan dejado de tomar menos de 14 días antes. (Martindale, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares: vasodilatación, síncope, taquicardia, rubor, dolor torácico, hipotensión ortostática, bradicardia, palpitaciones. (Taketomo, 2009).

Sistema Nervioso Central: mareo, cefalea, somnolencia, vértigo, agitación, ansiedad, confusión, convulsiones, labilidad emocional, euforia, alucinaciones, malestar general, nerviosismo, trastornos del sueño, amnesia, fiebre, insomnio. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: prurito, exantema, angiedema, síndrome de Stevens-Johnson, necrólisis epidérmica tóxica. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: síntomas menopáusicos (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: constipación, náusea, dolor abdominal, anorexia, diarrea, sequedad bucal, dispepsia, vómito, hemorragia gastrointestinal, pancreatitis. (Taketomo, 2009).

Genitourinarias: poliaquiuria, retención urinaria. (Taketomo, 2009).

Hematológicas: trombocitopenia. (Taketomo, 2009).

Hepáticas: insuficiencia hepática, hepatitis, colelitiasis. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: temblor, deterioro de la coordinación, hipertensión, espasticidad, debilidad, artralgias. (Taketomo, 2009).

Oculares: miosis, trastornos visuales. (Taketomo, 2009).

Renales: elevación de creatinina sérica. (Taketomo, 2009).

Respiratorias: broncoespasmo, disnea, depresión respiratoria, tos, congestión nasal. (Taketomo, 2009).

Diversas: diaforesis, anafilaxia, síndrome de abstinencia, síndrome



serotoninérgico, reacción
anafiloide. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C** (Taketomo, 2009).
- Debe usarse con precaución EXTREMA en pacientes que toman inhibidores de la MAO. (Taketomo, 2009).
- El uso prolongado puede ocasionar tolerancia o dependencia del fármaco. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

SOBREDOSIS

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un centro de toxicología. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Síntomas de sobredosis:

Frío, piel húmeda, confusión, convulsiones, mareos, somnolencia, nerviosismo severo, o inquietud severa, pupilas de los ojos, ritmo cardíaco lento, convulsiones, respiración lenta o difícil, debilidad. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

TRATAMIENTO EN CASOS DE SOBREDOSIS:

Ante un caso de sobredosis se puede realizar un tratamiento

antagónico específico con la administración de Naloxona, la cual invertirá algunos síntomas causados por una sobredosis con Tramadol. Administre la Naloxona con precaución porque puede causar un ataque súbito. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Para el tratamiento de convulsiones ocasionadas por la toxicidad del Tramadol, puede administrarse diazepam. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2897-2899..
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp.1678.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 131.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1230-1232.



TRIHIDRATO DE AMPICILINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Ampicilina Trihidrato.

FORMA FARMACEUTICA:

Solución Inyectable.
Cápsulas.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

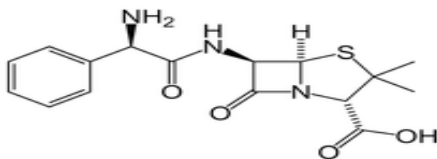
(2S,5R,6R)-ácido 7-(2-amino-2-fenilacetil)amino-3, 3-dimetil-6-oxo-2-tia-5-azabicyclo [3.2.0]heptano-4-carboxílico. (Martindale, 2009).

Sinónimos: Aminobencilpenicilina; Ampicilina Sódica; Trihidrato de Ampicilina. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antibiótico betalactámico. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

La Ampicilina se emplea en el tratamiento de diversas infecciones causadas por microorganismos sensibles como estreptococos, neumococos, enterococos, estafilococos no productores de penicilinasa, algunas cepas de *H. influenzae*, *E. coli*; como infecciones de las vías biliares, bronquitis, endocarditis, gastroenteritis (incluida enteritis por *salmonella* y shigellosis), gonorrea, listeriosis, meningitis, otitis media, infecciones estreptocócicas perinatales (profilaxis intraparto frente al estreptococo del grupo B), peritonitis, neumonía, septicemia, fiebre tifoidea y paratifoidea, e infecciones del aparato urinario. (Martindale, 2009).

En terapéutica empírica inicial de recién nacidos con sospecha de sepsis bacteriana o meningitis en combinación con un aminoglucósido o Cefotaxima; profilaxia de endocarditis. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Inhibe la síntesis de la pared celular bacteriana al unirse a una o más de las proteínas de unión a Penicilina (PBP), que a su vez inhiben el paso de transpeptidación final de la síntesis de peptidoglucanos en las



paredes celulares bacterianas, lo cual inhibe la biosíntesis de la pared celular. Esto produce la lisis bacteriana debido a la activación de las enzimas autolíticas de la pared celular mientras se detiene el ensamblado de la pared celular. (Lacy, 2011).

la orina sin modificaciones en 24 h; se excreta en bilis. (Taketomo, 2009).

- **Diálisis:** aproximadamente 40% se elimina por hemodiálisis. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** oral:
50%.(Taketomo, 2009).
- **Distribución:** hacia la bilis; penetra en líquido cefalorraquídeo sólo cuando las meninges están inflamadas; excreción baja en la leche materna. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:**
-Recién nacidos: 10%

-Adultos: 15 a 18%. (Taketomo, 2009).
- **Vida media:**
-**Recién nacidos:**
2 a 7 días: 4 h
8 a 14 días: 2.8 h
15 a 30 días: 1.7 h
Niños y adultos: 1 a 1.8 h
Pacientes anúricos: 8 a 20 h. (Taketomo, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima oral:**
1 a 2 h. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** aproximadamente 90% del fármaco se excreta por

DOSIS:

Rango usual de dosificación:

Lactantes y niños:

Oral: 50 a 100 mg/kg/día en dosis divididas cada 6 h (máximo: 2 a 4 g/día). (Lacy, 2011).

IM, IV: 100 a 400 mg/kg/día en dosis divididas cada 6 h (máximo: 12 g/día). (Lacy, 2011).

Adultos: oral, IM, IV: 250 a 500 mg cada 6 h. (Lacy, 2011).

Dosis con indicación específica:

Lactantes y niños:

Profilaxis contra endocarditis infecciosa: Procedimientos dentales, orales o de vías respiratorias: IM, IV: 50 mg/kg durante los primeros 30 a 60 min antes del procedimiento en pacientes sin alergias a Penicilina y que no pueden recibir Amoxicilina oral. Las inyecciones intramusculares deben evitarse en pacientes que reciben tratamiento anticoagulante. En estas circunstancias, los esquemas para administración oral deben proporcionarse siempre que sea posible. Los antibióticos administrados por vía intravenosa



deben utilizarse en pacientes incapaces de tolerar o absorber los medicamentos orales. (Lacy, 2011).

Procedimientos de sistema genitourinario y gastrointestinal; IM, IV:

Pacientes de alto riesgo: 50 mg/kg (máximo: 2 g) durante los primeros 30 min antes del procedimiento, seguidos de Ampicilina 25 mg/kg (o Amoxicilina oral 25 mg/kg) 6 h después, debe utilizarse en combinación con Gentamicina. (Lacy, 2011).

Infecciones leves a moderadas:

Oral: 50 a 100 mg/kg/día en dosis divididas cada 6 h (máximo: 2 a 4 g/día). (Lacy, 2011).

IM, IV: 100 a 150 mg/kg/día en dosis divididas cada 6 h (máximo: 2 a 4 g/día). (Lacy, 2011).

Infecciones graves, meningitis;
IM, IV: 200 a 400 mg/kg/día en dosis divididas cada 6 h (máximo: 6 a 12 g/día). (Lacy, 2011).

Adultos:

Actinomicosis: IV: 50 mg/kg/día durante 4 a 6 semanas, luego Amoxicilina oral. (Lacy, 2011).

Colangitis (aguda): IV: 2 g cada 4 h con Gentamicina. (Lacy, 2011).

Diverticulitis: IM, IV: 2 g cada 6 h con Metronidazol. (Lacy, 2011).

Endocarditis:

Infecciosa: IV: 12 g/día mediante infusión continua o divididos cada 4 h.

Profilaxis: dental, oral, o vías respiratorias; IM, IV: 2 g durante los primeros 30 a 60 min antes del procedimiento en pacientes sin alergias a Penicilina y que no pueden recibir Amoxicilina oral. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Hipersensibilidad a la Ampicilina (Penicilinas) o cualquier componente de la fórmula. (Taketomo, 2009).

Precauciones: La administración de Ampicilina debe interrumpirse si aparecen exantemas. Es preferible no administrarla a pacientes con mononucleosis infecciosa, ya que estos pacientes son especialmente sensibles a los exantemas inducidos por la Ampicilina; en pacientes con leucemia linfática o infección por el VIH puede también verse incrementado el riesgo de desarrollar exantemas. (Martindale, 2009).

Usar con cautela en pacientes asmáticos. Un alto porcentaje de pacientes con mononucleosis infecciosa ha desarrollado exantema durante el tratamiento con Ampicilina; los antibióticos de la clase de las ampicilinas no se recomiendan en estos pacientes. El exantema por Ampicilina ocurre en 5 a 10% de los niños que reciben Ampicilina y es un exantema



maculopapular generalizado rojizo apagado, que por lo general aparece 3 a 14 días después de comenzado el tratamiento. Es normal que comience en el tronco y se disemine sobre casi todo el cuerpo. Puede ser mas intenso en áreas de presión, codos y rodillas.² El uso prolongado puede ocasionar superinfecciones micóticas o bacterianas, que incluye diarrea relacionada con *C. difficile* (CDAD) y colitis pseudomembranosa; CDAD se ha observado > 2 meses después del tratamiento antibiótico. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante

Evitar el uso concomitante de Ampicilina con cualquiera de los siguientes: BCG.

Aumento del efecto/toxicidad

Ampicilina puede incrementar las concentraciones/efectos de: Metotrexato. (Lacy, 2011).

Las concentraciones/efectos de Ampicilina pueden incrementarse por: Alopurinol; Probenecid. (Lacy, 2011).

Disminución del efecto

Ampicilina puede disminuir las concentraciones/efectos de: Atenolol; BCG; Micofenolato; vacuna contra tifoidea. (Lacy, 2011).

Las concentraciones/efectos de Ampicilina pueden disminuir por: Cloroquina; Ácido Fusídico;

derivados de Tetraciclina. (Lacy, 2011).

Alimento: los alimentos disminuyen la velocidad de absorción de Ampicilina; pueden disminuir la concentración sérica de Ampicilina. (Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Puede interferir con pruebas de glucosa en orina que utilizan Sulfato Cúprico (Solución de Benedict). (Lacy, 2011).

Algunos derivados de Penicilina pueden acelerar la degradación de aminoglucósidos *in vitro*, lo cual ocasiona una subestimación potencial de la concentración sérica del aminoglucósido. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema Nervioso Central: convulsiones, cefalea, mareo, fiebre inducida por fármacos. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: exantema, urticaria, dermatitis exfoliativa, síndrome de Stevens-Johnson. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: diarrea (20%), náusea, vómito, glositis, enterocolitis pseudomembranosa, candidiasis bucal. (Taketomo, 2009).



Hematológicas: eosinofilia, anemia hemolítica, trombocitopenia, neutropenia, prolongación del tiempo de sangrado. (Taketomo, 2009).

Renales: nefritis intersticial. (Taketomo, 2009).

Diversas: anafilaxia, reacciones de hipersensibilidad, enfermedad del suero, vasculitis, sobreinfección. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **B** (Taketomo, 2009).
- **Interacción con alimentos:** el alimento disminuye velocidad y grado de absorción. (Taketomo, 2009).
- La infección por virus Epstein-Barr o citomegalovirus, y la leucemia linfocítica aguda aumentan el riesgo de exantema maculopapular inducido por ampicilina. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un Centro de Control de Envenenamientos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento de la sobredosis:

El tratamiento específico de hemodiálisis puede ayudar en la eliminación de las Penicilinas de la sangre. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Cuidados de apoyo: Puesto que no hay un antídoto específico, el tratamiento de Penicilina debe ser sintomático y de apoyo. Los pacientes en quienes se sabe o se sospecha una sobredosis intencional deben ser referidos para consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2342-2346.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp.126-128.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 204-205, 214.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México:



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Editorial Inter Sistemas. Lexi
Comp. Pp. 115.

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.
Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905
cegimed@intenett.com www.cegimed.org



TRIMETROPIN

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Trimetropin.

FORMA FARMACEUTICA:

Comprimido.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Nombre Químico:

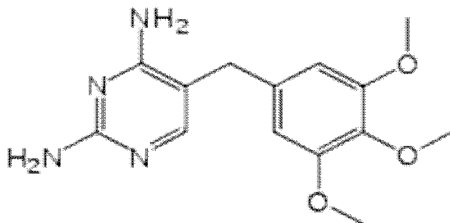
5 - (3,4,5-trimetoxibencil) pirimidina-2 ,4-diamina. (Taketomo, 2009).

Sinónimos: TMP. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antibiótico, diversos. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Tratamiento de infecciones de vías urinarias causadas por cepas sensibles de *Escherichia coli*, *Proteus mirabilis*, *Klebsiella pneumoniae*, especies de *Enterobacter* y *Staphylococcus coagulasa negativo* (inclusive *S. saprophyticus*); profilaxia de infecciones de vías urinarias; en combinación con otros agentes; para tratar neumonía por *Pneumocystis jiroveci*; terapéutica de otitis media ocasionada por *Streptococcus pneumoniae* sensible y *Haemophilus influenzae* (no indicado para *Moraxella catarrhalis* a causa de resistencia constante); no está indicado para administración prolongada o profilaxia de otitis media. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: se une a la enzima reductasa de Dihidrofolato en bacterias e inhibe la conversión de Ácido Dihidrofólico en Tetrahidrofolato (forma funcional del Ácido Fólico). Esto produce depleción de Ácido Fólico, interferencia con la biosíntesis bacteriana de ácidos nucleicos y la producción de proteínas, así como



inhibición de la proliferación microbiana. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción: oral:** se absorbe rápido y en grado considerable (90 a 100%). (Taketomo, 2009).
- **Distribución:** penetra hacia el líquido del oído medio, y alcanza una concentración máxima media en personas de 1 a 12 años de 2 ug/ml después de una sola dosis de 4 mg/kg; atraviesa la placenta, se excreta en la leche materna.

V_d :

-Recién nacidos:
aproximadamente 2.7 L/Kg.
(Taketomo, 2009).

-Lactantes: 1.5 L/Kg. (Taketomo, 2009).

-Niños: 1 a 10 años:
aproximadamente 1 L/Kg.
(Taketomo, 2009).

-Adultos: 1.3 a 1.8 L/Kg.
(Taketomo, 2009).

- **Unión a proteína:** 42 a 46%. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** se metaboliza parcialmente (10 a 20%) en el hígado, por desmetilación, oxidación e hidroxilación. (Taketomo, 2009).

- **Biodisponibilidad:** similar para tabletas y solución. (Taketomo, 2009).

- **Vida media (prolongada en disfunción renal):**

-Recién nacidos: 19 h

-Lactantes de 2 meses a 1 año:
3 a 6 h; promedio: 4.6 h

-Lactantes mayores y niños de 2 a 10 años: 3 a 5.5 h.
(Taketomo, 2009).

-Adultos, función renal normal:
8 a 11 h. (Taketomo, 2009).

-Adultos, anúricos: 20 a 50 h.⁴

- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:**
1 a 4 h. (Taketomo, 2009).

- **Eliminación:** se excreta en grado importante en la orina (60 a 80%) como medicamento sin modificaciones, mediante filtración glomerular y secreción tubular; la excreción renal aumenta con orina ácida. (Taketomo, 2009).

- **Diálisis:** moderadamente dializable (20 a 50%). (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Dosificación usual oral:



- **Lactantes \geq 6 meses y niños:**

otitis media aguada 10 mg/Kg/día divididos en dosis cada 12 h durante 10 días. (Taketomo, 2009).

- **Lactantes y niños $<$ 12 años:** infección de las vías urinarias:

-Tratamiento: 4 a 6 mg/Kg/día divididos en dosis cada 12 h durante 10 días. (Taketomo, 2009).

- **Niños \geq 12 años y adultos:** infección de vías urinarias:

-Tratamiento: 100 mg cada 12 h, o 200 mg cada 24 h hasta por 10 días. (Taketomo, 2009).

-Profilaxia: 100 mg una vez por día. (Taketomo, 2009).

-Tratamiento de neumonía por *Pneumocystis jirovecii* (administrado con dapsona): 15 a 20 mg/Kg/día divididos en cuatro dosis durante 21 días. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Hipersensibilidad al Trimetoprim o cualquier componente de la fórmula; anemia megaloblástica por deficiencia de folato. (Taketomo, 2009).

Precauciones:

Trimetoprim no debe ser administrado a pacientes con un antecedente de hipersensibilidad al fármaco, y debe ser suspenderse si aparece una erupción cutánea.³

Es necesario tener cuidado en dar Trimetoprim a los pacientes con insuficiencia renal para evitar la acumulación y la toxicidad: no se debe dar en la insuficiencia renal severa, a menos las concentraciones en sangre se puede controlar. Se debe utilizar con precaución en pacientes con daño hepático severo como pueden ocurrir cambios en la absorción y metabolismo de trimetoprim. (Martindale, 2009).

Trimetoprim por lo general no debe ser administrado a pacientes con graves trastornos hematológicos y sobre todo no en la anemia megaloblástica secundaria a la depleción de folato. Se debe tener cuidado en pacientes con renal, o posible deficiencia, ácido fólico y el uso de Ácido Fólico deben ser considerados. Trimetoprim debe evitarse durante el embarazo. Los pacientes ancianos pueden ser más susceptibles a los efectos adversos y una dosificación más baja puede ser aconsejable. (Martindale, 2009).

Trimetoprim se ha asociado con los ataques agudos de porfiria y se considera inseguro en pacientes porfíricos. (Martindale, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Trimetoprim puede aumentar las concentraciones séricas y potenciar el efecto de un número de fármacos, incluyendo Fenitoína, Digoxina, Procainamida, la

³ 3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Rosiglitazona, y Repaglinida.
(Martindale, 2009).

El efecto puede ser debido a la inhibición competitiva de la excreción renal, disminución del metabolismo, o ambos. Se ha sugerido que el Trimetroprim puede potenciar los efectos de la warfarina. (Martindale, 2009).

Trimetroprim ha sido informado a reducir la excreción renal y aumentar las concentraciones en sangre de Zidovudina, Zalcitabina, y Lamivudina. disminuir las concentraciones de trimetoprim. (Martindale, 2009).

Un aumento del riesgo de nefrotoxicidad se ha informado con el uso de Trimetroprim o Cotrimoxazol y Ciclosporina. El uso intravenoso de Trimetroprim y las sulfonamidas puede reducir las concentraciones de ciclosporina en sangre. La hiponatremia se ha reportado en los pacientes dada el trimetoprim con diuréticos. (Martindale, 2009).

El uso de trimetroprim con otros depresores del hueso función de la médula puede aumentar la probabilidad de mielosupresión, y puede haber un riesgo particular de anemia megaloblástica si se da con el ácido fólico otros inhibidores, tales como la pirimetamina o metotrexato. Hiperpotasemia grave se ha observado en los pacientes que recibieron Trimetroprim (o Clotrimoxazol), junto con un

Inhibidor de la ECA. (Martindale, 2009).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Valores alterados de laboratorio:

Los siguientes han sido seleccionados sobre la base de su potencial significancia clínica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Resultados de pruebas de diagnóstico:

Las determinaciones de:

-Creatinina: el Trimetroprim puede interferir con el ensayo de picrato alcalino para la creatinina, resultando en valores que son aproximadamente 10% mayor que los valores reales. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Los ensayos séricos de:

-Metotrexato: el Trimetroprim puede interferir con los ensayos de Metotrexato en suero si se mide por la técnica de la proteína de unión competitiva [CBPA] utilizando una dihidrofolato reductasa bacteriana como la proteína de unión; no ocurre ninguna interferencia si el Metotrexato se mide por radioinmunoensayo [RIA]. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



EFFECTOS ADVERSOS:

-Sistema Nervioso Central: fiebre, cefalea, meningitis aséptica (rara). (Taketomo, 2009).

-Dermatológicas: exantema, prurito, erupciones cutáneas, fototóxicas, dermatitis exfoliativa (rara), eritema multiforme (raro), síndrome de Stevens-Johnson (raro), necrólisis epidérmica tóxica (rara). (Taketomo, 2009).

-Endocrinas y metabólicas: hiperpotasemia, hiponatremia. (Taketomo, 2009).

-Hematológicas: anemia megaloblástica, neutropenia, leucopenia, trombocitopenia, metahemoglobinemia. (Taketomo, 2009).

-Hepáticas: elevación de enzimas hepáticas, ictericia colestática. (Taketomo, 2009).

-Gastrointestinales: náusea, vómito, molestias epigástricas, glositis. (Taketomo, 2009).

-Renales: elevación de nitrógeno ureico en sangre y creatinina. (Taketomo, 2009).

-Diversas: anafilaxia, reacciones de hipersensibilidad. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C** (Taketomo, 2009).
- Puede ocasionar deficiencias de folato con supresión de médula ósea y discrasias sanguíneas subsecuentes; vigilar en busca de fiebre, irritación faríngea, púrpura o palidez. (Taketomo, 2009).
- Suspender el Trimetropin si ocurre depresión de médula ósea; puede requerirse Leucovorin (Ácido Folínico) para restablecer la hematopoyesis normal. (Taketomo, 2009).
- **Interacción con alimentos:** El Trimetropin puede ocasionar deficiencia de Ácido Fólico; es posible que se requieran complementos. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Sobredosis:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un Centro de Control de Envenenamientos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: Los signos de sobredosis pueden producirse tras la ingestión de un gramo o más de trimetoprim. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Síntomas: Depresión de la médula ósea (escalofríos, fiebre o dolor de garganta, cansancio o debilidad inusual, rara vez, sangrado o moretones inusuales, heces negras, sangre en la orina o las heces; pequeñas manchas rojas en la piel), confusión, mareos, dolor de cabeza, depresión mental, náuseas o vómitos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1245.

Tratamiento de la sobredosis:

El tratamiento recomendado consiste en lo siguiente: lavado gástrico. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La atención de apoyo:

Los pacientes en quienes se sabe o se sospecha una sobredosis intencional deben ser referidos para consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2927.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 355, 356.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción

TROPICAMIDA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Tropicamida.

FORMA FARMACEUTICA:

Solución oftálmica.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

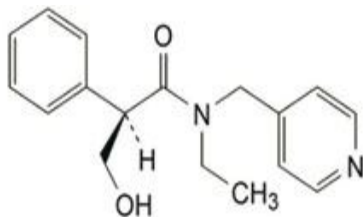
Tropicamida; Tropicamidum;
Tropikamid; 2RS)-N-etil-3-hidroxi-
2-fenil-N-(piridin-4-ilmethyl)propanamida. (Martindale, 2009).

Sinónimos: Bistropamida.
(Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente oftálmico midriático.
(Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

La Tropicamida es un antimuscarínico con estructura de amina terciaria y acciones similares a las de la atropina. (Martindale, 2009).

Se emplea como colirio para provocar midriasis y cicloplejía. (Martindale, 2009).

Midriático de acción breve utilizado en procedimientos diagnósticos, tanto en el periodo preoperatorio como en el posoperatorio; tratamiento de algunos casos de iritis aguda, iridociclitis y queratitis. (Taketomo, 2009).

Presenta un inicio de acción mas rápido y una duración de acción mas reducida que la Atropina; la midriasis se produce entre 20 y 40 min después de la instilación y suele durar aproximadamente 6h; la cicloplejía es máxima al cabo de unos 30 min y tiene una duración reducida. (Martindale, 2009).

La Tropicamida no se considera adecuada para la cicloplejía en niños. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:



Mecanismo de Acción: La Tropicamida evita que el músculo del esfínter del iris y el músculo del cuerpo ciliar respondan a la estimulación colinérgica, y produce dilatación pupilar y parálisis de la acomodación. (Taketomo, 2009).

Midriasis: instilar una a dos gotas (al 0.5%) 15 a 20 min antes del examen; puede repetirse cada 30 min según se requiera. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Comienzo de la acción:** rápida. (Taketomo, 2009).

- **Efecto midriático máximo:** 20 a 40 min. (Taketomo, 2009).

Duración: 6 a 7 h.

- **Efecto ciclopléjico máximo:**

Máximo: 20 a 35 min. (Taketomo, 2009).

Duración: < 6 h. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Niños y adultos: oftálmica:

Cicloplejía: instilar una o dos gotas (al 1%); la aplicación puede repetirse en 5 min. Realizar el examen en los 30 min posteriores a la última dosis; si el paciente no se explora en 20 a 30 min, instilar una gota adicional. Las concentraciones < al 1% son inadecuadas para producir cicloplejía satisfactoria. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Tropicamida o cualquier componente de la fórmula; glaucoma, sinequias entre iris y cristalino. (Taketomo, 2009).

Precauciones: Usar con cautela en lactantes y niños porque Tropicamida puede causar trastornos del SNC potencialmente peligrosos y reacciones psicóticas. (Taketomo, 2009).

No debe administrarse en pacientes con miastenia grave, excepto para reducir los efectos adversos antimuscarínicos de una anticolinesterasa. (Martindale, 2009).

No debería administrarse en pacientes con glaucoma de ángulo cerrado o ángulo estrecho entre el iris y la córnea, ya que alcanza la presión intraocular y desencadena un ataque agudo. Algunos autores recomiendan que el colirio no se utilice en recién nacidos de menos de 3 meses debido a su posible asociación entre la cicloplejía inducida y el desarrollo de ambliopía. (Martindale, 2009).

Los antimuscarínicos deben administrarse con precaución en



trastornos caracterizados por taquicardia, como en la tirotoxicosis, la insuficiencia cardíaca y en cirugía cardíaca, donde puede acelerar la frecuencia cardíaca. (Martindale, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Los efectos de los antimuscarínicos pueden intensificarse por la administración concomitante de otros fármacos con propiedades antimuscarínicas, como la Amantadina, algunas Antihistaminas, Antipsicóticos Fenotiazínicos y Antidepresivos Tricíclicos. La inhibición de enzimas metabolizadoras de fármacos por IMAO probablemente podría aumentar los efectos de los antimuscarínicos. La reducción de la motilidad gástrica causada por los antimuscarínicos puede afectar a la absorción de otros fármacos. (Martindale, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Oculares: visión borrosa, fotofobia, hipertensión intraocular, conjuntivitis folicular. (Taketomo, 2009).

Cardiovasculares: taquicardia, bochornos. (Taketomo, 2009).

SNC: estimulación parasimpática, estado soporoso, cefalea, trastornos de la conducta, reacciones psicóticas. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales: xerostomía. (Taketomo, 2009).

Locales: sensación punzante transitoria. (Taketomo, 2009).

Diversas: reacciones alérgicas. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C** (Taketomo, 2009).
- La Tropicamida puede ocasionar aumento de la presión intraocular. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

En caso de sobredosificación, los efectos periféricos pueden llegar a ser más acusados y podrían producirse otros síntomas como hipertermia, hipertensión, aumento de la frecuencia respiratoria, náuseas y vómitos. Las dosis tóxicas también causan estimulación del SNC, caracterizada por inquietud, confusión, excitación, ataxia, paranoia, alucinaciones y delirio, y ocasionalmente rigidez. Sin embargo, en la intoxicación grave, la estimulación central puede conducir a depresión del SNC, coma, insuficiencias circulatoria y respiratoria, y muerte. (Martindale, 2009).

Existe una variación considerable en la sensibilidad a la atropina;



existen casos de recuperación incluso tras la administración de 1 g, mientras que se han descrito fallecimientos por dosis de 100 mg o inferiores en adultos y 10 mg en niños. (Martindale, 2009).

La toxicidad sistémica puede producirse por la instilación local de antimuscarínico en forma de colirio, particularmente en niños y personas de edad avanzada. (Martindale, 2009).

REFERENCIAS:

1. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1886, 1219-1220.
2. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1252.



VALACYCLOVIR HYDROCHLORIDE

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Valaciclovir Clorhidrato.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas recubiertas.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

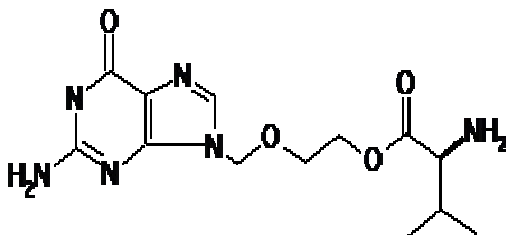
Hidrocloruro de valaciclovir, L-valina, éster con 9 - [(2-hidroxietoxi) metil] guanina hidrocloruro. (Martindale, 2009).

Sinónimos: Clorhidrato de Valaciclovir. (Taketomo, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antiviral oral. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

El Valaciclovir es un profármaco del Aciclovir que se usa en el tratamiento de las infecciones por herpes zóster y herpes simple en la piel y las mucosas. (Lacy, 2011).

También se emplea para el tratamiento de la primera crisis del herpes genital y su recurrencia; supresión del herpes genital recurrente y disminución de transmisión heterosexual de herpes genital en pacientes con inmunocompetencia; supresión del herpes genital en individuos infectados por VIH; tratamiento del herpes labial; varicela en niños inmunocompetentes. (Lacy, 2011).

Uso no autorizado/de investigación: Profilaxia de infecciones por HSV, VZV Y CMV relacionadas con el cáncer; tratamiento de la infección por HSV, VZV, relacionada con el cáncer. (Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción
Valaciclovir es un profármaco que se convierte casi completamente a Aciclovir y L-valina. Debido a su fosforilación más eficiente por la Timidina quinasa vírica, la actividad



antiviral Aciclovir es mayor contra el herpes simple virus tipo 1 (VHS-1), El Aciclovir es fosforilado por la Timidina quinasa para el monofosfato de Aciclovir, que después se convierte en Difosfato y Trifosfato de Aciclovir por células enzimáticas. Aciclovir se convierten selectivamente a la forma activa Trifosfato por las células infectadas con el virus del herpes. El Aciclovir Trifosfato inhibe la replicación del ADN del herpes viral por inhibición competitiva de la ADN polimerasa viral, y por la incorporación en y terminación de la cadena creciente de ADN viral. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

aldehídos (metabolitos inactivos). (Lacy, 2011).

- **Biodisponibilidad:** aproximadamente 55% una vez convertido en aciclovir. (Lacy, 2011).
- **Vida media, eliminación:** función renal normal: adultos: Aciclovir: de 2.5 a 3.3 h, Valaciclovir: aproximadamente 30 min; con nefropatía terminal: Aciclovir: 14 a 20 h; durante hemodiálisis: 4 h. (Lacy, 2011).
- **Excreción:** principalmente en orina, como Aciclovir (89%). (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** rápida. (Lacy, 2011).
- **Distribución:** el Aciclovir se distribuye ampliamente en el cuerpo, incluidos cerebro, riñones, pulmones, hígado, bazo, músculo, útero, vagina y LCR. (Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** 14 a 18%. (Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático; el Valaciclovir se convierte de manera rápida y casi completa en Aciclovir y L-valina por efecto de primer paso; su metabolismo es hepático en un grado muy pequeño por acción de la oxidasa de aldehídos y por la deshidrogenasa alcohólica y de

DOSIS:

Dosis oral:

- **Niños 2 a ≤ 18 años de edad:**

Varicela: 20 mg/Kg/dosis cada 8 h durante 5 días (máximo: 1 g c/8 horas. (Lacy, 2011).

- **Niños ≥ 12 y adultos:**

Herpes labial: 2 g dos veces/día durante 1 día (fraccionar la dosis por aproximadamente 12 h). (Lacy, 2011).

- **Adultos:**

-Profilaxia de CMV en receptores de HSCT alogénicos (uso no



autorizado): 2 g cada 6 h. (Lacy, 2011).

-Herpes zoster: 1 g cada 8 h durante 7 días (Lacy, 2011).

-HSV, VZV, en pacientes oncológicos (uso no autorizado): profilaxia: 500 mg cada 8 a 12 h; tratamiento: 1 g cada 8 h. (Lacy, 2011).

-Herpes genital:
Crisis inicial: 1 g cada 12 h durante 10 días.

Crisis recurrente: 500 mg cada 12 h durante 3 días. (Lacy, 2011).

-Tratamiento supresor:

Pacientes inmunocompetentes: 1000 mg 1 vez/día (500 mg 1 vez/día en pacientes con ≤ 9 recurrencias por año). (Lacy, 2011).

Pacientes infectados por VIH ($CD4 \geq 100$ células/mm³): 500 mg cada 12 h. (Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Hipersensibilidad al Valaciclovir, Aciclovir, o cualquier componente de la formulación. (Lacy, 2011).

Precauciones: Usar con cautela en pacientes con disfunción renal o individuos que reciben de manera concomitante otros fármacos nefrotóxicos; modificar la dosis en

pacientes con disfunción renal. (Taketomo, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Cardiovasculares:

Hipertensión, taquicardia, edema facial. (Taketomo, 2009).

Sistema Nervioso Central:

Cefalea, mareo, fiebre. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas:

Exantema. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y Metabólicas:

Deshidratación, dismenorrea. (Taketomo, 2009).

Gastrointestinales:

Náusea, dolor abdominal, vómito, diarrea. (Taketomo, 2009).

Hematológicas:

Neutropenia, trombocitopenia, PTT/SUT (raras). (Taketomo, 2009).

Hepáticas:

Elevación de AST, ALT y fosfatasa alcalina, hepatitis. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas:

Artralgias. (Taketomo, 2009).

Renales:

Elevación de creatinina, insuficiencia renal. (Taketomo, 2009).

Respiratorias:



Rinorrea, nasofaringitis. (Taketomo, 2009).

Diversas:

Anafilaxia. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Se informan púrpura trombocitopénica trombótica/síndrome urémico hemolítico (PTT/SUT) en pacientes inmunocomprometidos (trasplante de médula ósea o renal. O enfermedad por VIH avanzada) con dosis de 8 g/día. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Sobredosis:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un Centro de Control de Envenenamientos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Efectos clínicos de la sobredosis:

Nota: Hasta la fecha, no existe información limitada sobre la sobredosis con Valaciclovir, se han observado casos de sobredosis oral de Aciclovir de hasta 20 gramos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Síntomas: Dolor de cabeza confusión, náuseas y vómitos han sido asociados con la sobredosis.

Tratamiento de la sobredosis

Para disminuir la absorción, el carbón activado puede ser utilizado para facilitar la eliminación del Valaciclovir no absorbido. El tratamiento es sintomático y de soporte. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2945-2948.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1771-1773.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 911.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1293.



VALERATO DE BETAMETASONA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Valerato de Betametasona.

FORMA FARMACEUTICA:

Crema Tópica y Loción (solución tópica).

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

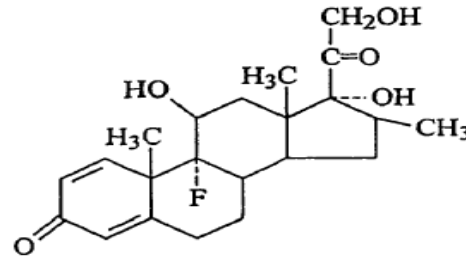
Valerato de Betametasona.
Betametasona 17 α -valerato.
(Martindale, 2009).

Sinónimos: Dipropionato de Betametasona, Dipropionato de Betametasona potenciado; Flubenisolona; Fosfato Sódico de Betametasona; Valerato de Betametasona. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Corticosteroides anti-séptico (OTIC), anti-inflamatoria (esteroide)
Corticosteroide sistémico;
Corticosteroide suprarrenal;
Corticosteroide tópico,
Glucocorticoide. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

La Betametasona es un corticosteroide con actividad principalmente glucocorticoide. Se ha utilizado en forma de alcohol libre o una de las formas esterificadas en el tratamiento de procesos en los que están indicados los corticosteroides, excepto los estados de insuficiencia suprarrenal en los que se prefiere hidrocortisona con Fludrocortisona. Prácticamente carece de propiedades mineralocorticoides, lo que hace que el fármaco sea especialmente apropiado para tratar procesos en los que no es conveniente la retención de agua. (Martindale, 2009).

Uso: antiinflamatorio, inmunosupresor.



Tópico: dermatosis inflamatorias como psoriasis, dermatitis seborreica o atópica, neurodermatitis, fase inflamatoria de xerosis, fase tardía de dermatitis alérgica o por irritantes. (Taketomo, 2009).

Valerato de Betametasona se ha utilizado también por inhalación para la profilaxis del asma. (Martindale, 2009).

péqueñas cantidades por la leche materna. (Martindale, 2009).

En la circulación, la mayoría se unen ampliamente a las proteínas plasmáticas, en mayor medida a la globulina y en menor proporción a la albúmina. (Martindale, 2009).

Se metabolizan principalmente en el hígado, pero también lo hacen en otros tejidos, y se excretan por la orina. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: controla la velocidad de síntesis proteica, disminuye la migración de polimorfonucleares y fibroblastos, revierte la permeabilidad capilar y causa estabilización de lisosomas, con lo cual previene o controla la inflamación. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Tópica:

≤ 12 años: no se recomienda su uso. (Lacy, 2011).

≥ 13 años: utilizar una cantidad mínima durante el periodo más corto para evitar la supresión del eje HPA. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

Se absorben rápidamente en el tubo digestivo, también se absorben desde las zonas de administración local. Cuando se utilizan por vía tópica, en particular bajo un vendaje oclusivo o cuando la piel esta lesionada, así como en forma de enema rectal, el corticosteroide puede absorberse en cantidad suficiente para provocar efectos sistémicos. (Martindale, 2009).

Se distribuyen rápidamente en todos los tejidos del organismo. Atraviesan la barrera placentaria en diversos grados y se excretan en

- **Loción:** aplicar unas cuantas gotas 2 veces al día. Fórmula concentrada: aplicar unas cuantas gotas 1 o 2 veces al día; frotar con suavidad. (Lacy, 2011).

Nota: no sobrepasar las 2 semanas de tratamiento o 50 mL/semana. (Lacy, 2011).

- **Gel:** fórmula concentrada: aplicar 1 o 2 veces al día, frotar con suavidad. (Lacy, 2011).

Nota: no sobrepasar las 2 semanas de tratamiento o 50 mL/semana. (Lacy, 2011).



- **Crema:** aplicar 1 o 2 veces al día. Fórmula concentrada: aplicar 1 o 2 veces al día. (Lacy, 2011).

Nota: no sobrepasar las 2 semanas de tratamiento o 45 mL/semana. (Lacy, 2011).

ADOLESCENTES Y ADULTOS:

Tópica:

Loción: aplicar unas cuantas gotas 2 veces al día. (Lacy, 2011).

Fórmula concentrada: aplicar unas cuantas gotas 1 o 2 veces al día; frotar con suavidad. (Lacy, 2011).

Nota: no sobrepasar las 2 semanas de tratamiento o 50 mL/semana. (Lacy, 2011).

- **Crema:** aplicar 1 o 2 veces al día.

Fórmula concentrada: aplicar 1 o 2 veces al día. (Lacy, 2011).

Nota: no sobrepasar las 2 semanas de tratamiento o 45 g/semana. (Lacy, 2011).

contraindicada en púrpura trombocitopénica idiopática. (Lacy, 2011).

Precauciones: Evitar la administración de dosis más altas que las recomendadas; pueden presentarse supresión del eje HHS, detención de la velocidad de crecimiento, disminución de la densidad mineral ósea, hiperglucemia, síndrome de Cushing. (Taketomo, 2009).

Usar con cautela extrema en pacientes con tuberculosis del aparato respiratorio, infecciones sistémicas no tratadas o herpes simple ocular. (Taketomo, 2009).

Usar con cautela en pacientes con disfunción tiroidea, cirrosis, hipertensión, colitis ulcerativa, osteoporosis, disfunción renal, infarto del miocardio reciente, insuficiencia cardíaca congestiva, trastornos convulsivos, diabetes, úlcera péptica, glaucoma. (Taketomo, 2009).

Su uso prolongado puede dar como resultado la formación de cataratas o glaucoma. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Betametasona, otros corticoesteroides o a cualquier componente de la fórmula; infecciones micóticas sistémicas; la administración IM está

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

La utilización simultánea con Barbitúricos, Carbamazepina, Fenitoína, Primidona o Rifampicina incrementa el metabolismo y reduce los efectos de los corticosteroides por vía sistémica. (Martindale, 2009).



En contraposición los anticonceptivos orales o el Ritonavir incrementan la concentración plasmática de corticosteroides. (Martindale, 2009).

El empleo con diuréticos eliminadores de Potasio, como las Tiazidas o Furosemida, causa una pérdida excesiva de Potasio. También incrementa el riesgo de hipopotasemia con la administración simultánea de Anfotericina B o tratamiento broncodilatador con xantinas o agonistas B_2 . (Martindale, 2009).

Se produce un aumento de la incidencia de úlcera gastrointestinal y de hemorragia cuando se administran con AINE. Altera la respuesta a los anticoagulantes y aumentan los requerimientos de fármacos antidiabéticos y antihipertensores, al igual que disminuye la concentración sérica de los salicilatos y el efecto de los antimuscarínicos en la miastenia grave. (Martindale, 2009).

Analgésicos: La concentración plasmática de salicilatos disminuye con el uso concomitante de corticosteroides. Esta interacción probablemente sea importante en pacientes que reciben tratamiento a largo plazo con dosis elevadas de salicilatos. Y a la inversa, podría producirse intoxicación por salicilatos si se suprimen los corticosteroides. (Martindale, 2009).

Antibacterianos: la Rifampicina disminuye la actividad de los

corticosteroides mediante la aceleración de su metabolismo y cabe esperar un efecto similar con otras rifamicinas. (Martindale, 2009).

Antiepilépticos: ocurre una reducción de la eficacia de los corticosteroides en los enfermos asmáticos, artríticos, sometidos a trasplante renal y otros pacientes que recibían Fenitoína o Fenobarbital. (Martindale, 2009).

Hormonas sexuales: se exponen casos de aumento del efecto de los corticosteroides en mujeres que toman estrógenos o anticonceptivos orales y señalan que es necesario en algunos casos disminuir la dosis de corticosteroides. (Martindale, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

SNC: vértigo, confusión, convulsiones, cefalea, psicosis, seudotumor cerebral, euforia, insomnio, hipertensión intracraneal, nerviosismo. (Taketomo, 2009).

Cardiovasculares: hipertensión, edema, insuficiencia cardiaca congestiva. (Taketomo, 2009).

Dermatológicas: adelgazamiento y fragilidad cutánea, hiperpigmentación o hipopigmentación, acné, atrofia cutánea, eritema, exantema y sequedad de la piel. (Taketomo, 2009).



Gastrointestinales: vómito, náusea, úlcera péptica. (Taketomo, 2009).

Oculares: cataratas, hipertensión intraocular, glaucoma. (Taketomo, 2009).

Endocrinas y metabólicas: supresión HHS, estado cushinoide, retención de sodio y agua, hipopotasemia, supresión del crecimiento. (Taketomo, 2009).

Neuromusculares y esqueléticas: debilidad muscular, osteoporosis, fracturas. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **C** (Lacy, 2011).
- Interacciones con alimentos: Betametasona interfiere con la absorción del calcio. (Lacy, 2011).
- Es posible que ocurra supresión del eje hipotalámico-hipofisario-suprarrenal (HHS); puede presentar insuficiencia suprarrenal con la suspensión abrupta tras uso prolongado o estrés; debe suspenderse con cuidado. Los corticosteroides también pueden enmascarar los signos de infección, también pueden activar infecciones latentes oportunistas o exacerbar las infecciones micóticas sistémicas. (Taketomo, 2009).

- Pueden causar osteoporosis (a cualquier edad) o inhibición del crecimiento óseo en pacientes pediátricos. Puede presentar miopatía aguda con dosis elevadas, también pueden presentarse efectos en el SNC (que van desde euforia hasta psicosis). (Taketomo, 2009).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 1013.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 207-209.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1494-1495, 1519.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 173-174.



VALSARTAN

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Valsartán.

FORMA FARMACEUTICA:

Comprimido recubierto.
Cápsula.

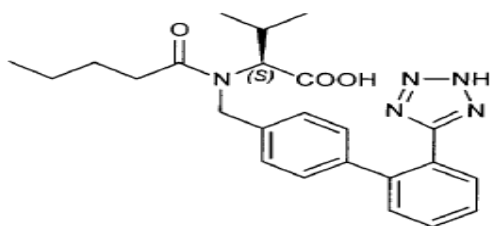
NOMBRE QUÍMICO:

N-[p-(o-1HTetrazol-5-ilfenil) bencil]-N-valeril-L-valina, N-pentanoil-N-[2'-(1H-tetrazol-5-il) bifenil-4-ilmetil]-L-valina. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antihipertensivo; Bloqueador del receptor de angiotensina II. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Para el tratamiento de hipertensión esencial, solo o combinado con otros antihipertensivos (autorizado por la FDA en > 6 años); reducción de la mortalidad cardiovascular en pacientes con insuficiencia del ventrículo izquierdo con estabilidad clínica o disfunción ventricular izquierda tras el infarto del miocardio. (Taketomo, 2009).

Valsartán se administra por vía oral. Después de una dosis del hipotensor efecto se produce dentro de 2 horas, alcanza un pico dentro de 4 a 6 horas, y persiste durante más de 24 horas. El máximo efecto hipotensor se alcanza en 2 a 4 semanas. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: bloquea la unión de la angiotensina II al receptor subtipo AT1. Induce sus efectos hipotensores al antagonizar vasoconstricción, liberación de aldosterona, catecolaminas y arginina-vasopresina. Esta acción induce un bloqueo más eficaz de las acciones cardiovasculares de la angiotensina II y menos efectos colaterales que los IECA. (Taketomo, 2009).



No afecta a la ECA (cinasa II) o la respuesta a bradicinina. (Taketomo, 2009).

sobretudo sin cambios; 20% se recupera como metabolitos. (Taketomo, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** se absorbe rápidamente tras la administración oral con una biodisponibilidad de alrededor del 23%. (Martindale, 2009).
- **Distribución:** adultos: V_d : 17 L. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:** se une de un 94 a 97% a las proteínas plasmáticas. (Martindale, 2009).
- **Metabolismo:** en un metabolito inactivo (valeril-4-hidroxi-valsartán). (Taketomo, 2009).
- **Biodisponibilidad:**
Tabletas: 25% (intervalo: 10 a 35).
Suspensión: aproximadamente 40% (aproximadamente 1.6 veces más que la tableta). (Taketomo, 2009).
- **Vida media, eliminación:** adultos: aproximadamente 6 h. (Taketomo, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:**
Tabletas (adultos): 2 a 4 h;
suspensión (niños): 2 h. (Taketomo, 2009).
- **Eliminación:** se excreta en heces (83%) y orina (13%)

- **Diálisis:** no se elimina mediante hemodiálisis. (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Dosis Oral:

Hipertensión:

Niños de 6 a 16 años de edad: inicial: 1.3 mg/kg/día (máximo: 40 mg/día); la dosis puede aumentarse hasta alcanzar el efecto deseado; no se han estudiado dosis \geq 2.7 mg/kg (máximo: 160 mg). (Lacy, 2011).

Adultos: inicial: 80 a 160 mg 1 vez/día (en quienes no presentan disminución de volumen); la dosis se puede aumentar hasta alcanzar el efecto deseado; máxima dosis recomendada: 320 mg/día. (Lacy, 2011).

Insuficiencia cardíaca: adultos: Inicial: 40 mg cada 12 h; ajustar la dosis a 80 a 160 mg cada 12 h; según tolere; dosis diaria máxima: 320 mg. (Lacy, 2011).

Disfunción ventricular izquierda después de MI: adultos: inicial: 20 mg cada 12 h; ajustar la dosis hasta una diana de 160 mg cada 12 h; según se tolere; se puede iniciar \geq 12 h después del MI. (Lacy, 2011).



CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Hipersensibilidad a Valsartán, otros bloqueadores de los receptores de angiotensina II o cualquier componente de la fórmula. (Taketomo, 2009).

Precauciones: esta contraindicado en pacientes con alteración hepática, cirrosis hepática u obstrucción biliar. (Martindale, 2009).

Usar con cautela en pacientes con disfunción hepática (su depuración se reduce en ellos). Utilizar con precaución en caso de disfunción renal; es posible que se presenten incrementos ligeros de la creatinina sérica al iniciar su administración; podría presentarse hiperpotasemia; sus factores de riesgo incluyen disfunción renal, diabetes mellitus. (Taketomo, 2009).

Puede desencadenar hipotensión sintomática, en especial en pacientes con activación del sistema renina-angiotensina. (Taketomo, 2009).

No se recomienda en niños < 6 años debido a cuestiones de seguridad potenciales. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Los efectos antihipertensivos pueden ser potenciados por las drogas u otros agentes que disminuyen la presión arterial.

Un efecto aditivo hiperpotasémico es posible con suplementos de Potasio, Diuréticos ahorradores de Potasio, u otras drogas que pueden causar hiperpotasemia, y Diuréticos ahorradores de Potasio por lo general no deben darse juntas. (Martindale, 2009).

Los (AINE) deben utilizarse con precaución en pacientes que tomaban Valsartán como el riesgo de insuficiencia renal se puede aumentar, particularmente en aquellos que no están bien hidratado, el uso de (AINE) también puede atenuar el efecto hipotensor del valsartán. (Martindale, 2009).

Algunos otros antagonistas de la angiotensina II son metabolizados por las isoenzimas del citocromo P450 y las interacciones pueden ocurrir con las drogas que afectan a estas enzimas. (Martindale, 2009).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Estudios basales y periódicos de electrolitos, función renal, BP; en el CHF, determinación de potasio sérico durante el aumento de la dosis y a continuación de forma periódica. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

No se han identificado diferencias significativas en los efectos colaterales en adultos y niños. (Taketomo, 2009).



Cardiovascular: Palpitaciones.
(Taketomo, 2009).

Dermatológicas: Prurito y rash.
(Taketomo, 2009).

Digestivas: Constipación, boca seca, dispepsia y flatulencia.
(Taketomo, 2009).

Musculoesqueléticas: Dolor lumbar, calambres y mialgias.
(Taketomo, 2009).

Neurológicas y psíquicas: Ansiedad, insomnio, parestesias y miastenia. (Taketomo, 2009).

Respiratorias: Disnea. (Taketomo, 2009).

Sensaciones especiales: Vértigo.
(Taketomo, 2009).

Urogenitales: Impotencia.
(Taketomo, 2009).

Otras reacciones relacionadas con menor frecuencia son: Dolor torácico, síncope, anorexia, vómitos y angioedema. (Taketomo, 2009).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **D** (Lacy, 2011).
- Interacciones con alimentos: su presencia disminuye la concentración plasmática máxima y el grado de absorción 50 y 40% respectivamente. (Lacy, 2011).

- Motilidad y mortalidad fetal y neonatal:

Las drogas que actúan sobre el sistema renina-angiotensina pueden causar mortalidad y muerte fetal y neonatal cuando son administradas a mujeres embarazadas sobre todo durante el segundo y el tercer trimestre. Si durante el tratamiento se detecta un embarazo, la medicación debe ser suspendida. (Taketomo, 2009).

- Se refieren hipotensión, hipoplasia craneana, anuria, insuficiencia renal, oligohidramnios (vinculado a detención del crecimiento de extremidades, hipoplasia pulmonar, deformaciones craneofaciales), retraso del crecimiento intrauterino. (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Para obtener más información sobre la gestión de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un centro de control de envenenamientos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Síntomas: bradicardia, hipotensión mareos, vahídos o desmayos, taquicardia. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento de la sobredosis:



El tratamiento debe ser sintomático y de apoyo, no se elimina del plasma mediante diálisis. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2957-2958.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1776-1777.
3. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1327, 1420.
4. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1297.



VENLAFAXINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Venlafaxina.

FORMA FARMACEUTICA:

Cápsulas de acción prolongada.
Tabletas recubiertas de acción prolongada.

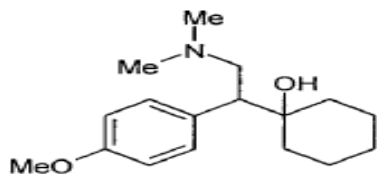
NOMBRE QUÍMICO:

Hidrocloruro de venlafaxina, (RS) -1 - (2-dimetilamino-1-p-methoxyphenylethyl) ciclohexanol clorhidrato. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Antidepresivo inhibidor de la recaptura de serotonina/norepinefrina. (Taketomo, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale 2009

INDICACIONES:

Tratamiento de depresión, trastorno de ansiedad generalizada, trastorno de ansiedad social (fobia social), trastornos de pánico; prevención de recurrencia o recidiva de depresión; se ha utilizado también para tratar trastorno por déficit de atención/hiperactividad (TDA/H) y autismo en niños; trastorno obsesivo-compulsivo y síndrome de fatiga crónica en adultos. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: La Venlafaxina y su metabolito activo, O-desmetilvenlafaxina (ODV), son inhibidores potentes de la recaptación de la Serotonina y Noradrenalina neuronales, e inhibidores débiles de la recaptación de Dopamina. La Venlafaxina y ODV no tienen actividad significativa sobre receptores muscarínicos colinérgicos, H₁-histaminérgicos o adrenérgicos alfa₂. La Venlafaxina y la ODV no poseen actividad inhibitoria de la MAO. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** oral: ≥ 92%; los alimentos no tienen efecto significativo sobre la absorción



del fármaco o la formación de su metabolito activo. (Taketomo, 2009).

- **Distribución:** V_{dss} : Venlafaxina 7.5 ± 3.7 L/Kg, ODV 5.7 ± 1.8 L/Kg. (Taketomo, 2009).
- **Unión a proteínas:** Venlafaxina $27\% \pm 2\%$, ODV $30\% \pm 12\%$. (Taketomo, 2009).
- **Metabolismo:** hepático a través de CYP2D6 hasta el metabolito activo, O-desmetilvenlafaxina (ODV); otros metabolitos incluyen N-desmetilvenlafaxina y N-O-didesmetilvenlafaxina. (Taketomo, 2009).
- **Biodisponibilidad:** oral. $\sim 45\%$. (Taketomo, 2009).
- **Vida media, eliminación:** Venlafaxina: 5 ± 2 h, ODV: 11 ± 2 h; prolongada en presencia de cirrosis (Venlafaxina: 30% , ODV: $\sim 60\%$), disfunción renal (Venlafaxina: $\sim 50\%$, ODV: $\sim 40\%$), y durante la diálisis (Venlafaxina: $\sim 180\%$, ODV: $\sim 142\%$). (Taketomo, 2009).
- **Tiempo de concentración máxima:**
Forma de liberación inmediata:
Venlafaxina: 2 h, ODV: 9 h
Forma de liberación prolongada:
Venlafaxina: 5.5 h, ODV: 9 h. (Taketomo, 2009).
- **Excreción:** en orina ((aproximadamente 87% ; 5% de la dosis total sin cambios; 29% como ODV no conjugada; 26%

de la dosis total como ODV conjugada; 27% como metabolitos inactivos menores). (Taketomo, 2009).

DOSIS:

Oral:

Niños y adolescentes:

Trastorno de déficit de atención/hiperactividad (uno no autorizado) inicial: 12.5 mg/día. (Lacy, 2011).

Niños < 40 kg: aumentar por 12.5 mg/semana hasta un máximo de 50 mg/día en 2 dosis divididas. (Lacy, 2011).

Niños ≥ 40 kg: aumentar 25 mg/semana hasta un máximo de 75 mg/día en 3 dosis divididas.

Dosis promedio: 60 mg o 1.4 mg/kg administrados en 2 a 3 dosis divididas. (Lacy, 2011).

Adultos:

Depresión:

Tabletas de liberación inmediata: inicial: 75 mg/día, suministrados en 2 o 3 dosis divididas; puede aumentarse a razón de ≤ 75 mg/día a intervalos de ≥ 4 días, según se tolere (dosis máxima diaria $225/375$ mg).

Cápsulas o Tabletas de liberación prolongada:

inicial: 37.5 a 75 mg 1 vez/día; en pacientes que iniciaron con 37.5 mg 1 vez/día se puede aumentar a 75 mg 1 vez/día después de 4 a 7 días; la dosis puede después incrementarse a



razón de ≤ 75 mg/día a intervalos ≥ 4 días, según se tolere (dosis máxima diaria: 225 mg). (Lacy, 2011).

Trastorno de ansiedad generalizada: cápsula de liberación prolongada: inicial: 37.5 a 75 mg 1 vez/día; en pacientes que inician con 37.5 mg 1 vez/día se puede aumentar a 75 mg 1 vez/día después de 4 a 7 días; después se puede incrementar a razón de ≤ 75 mg/día a intervalos de ≥ 4 días, según se tolere (dosis máxima diaria: 225 mg). (Lacy, 2011).

Trastorno de pánico: cápsula de liberación prolongada: inicial: 37.5 mg 1 vez/día durante 1 semana; se puede aumentar a 75 mg 1 vez/día después de 7 días y, a continuación, a razón de ≤ 75 mg/día a intervalos ≥ 7 días (dosis máxima diaria: 225 mg). (Lacy, 2011).

ajuste de la dosis. También hay que ser cauto con pacientes con antecedentes de infarto de miocardio o cardiopatía inestable, o cuya enfermedad pueda exacerbarse por un aumento de la frecuencia cardíaca. El control de la presión arterial puede ser apropiado. La Venlafaxina debe emplearse también con cautela en pacientes con antecedentes de epilepsia, y el tratamiento debe cesar, si en cualquier paciente se producen crisis convulsivas. En pacientes con historial de manía o hipomanía, debe emplearse también con cautela. Pacientes con una presión intraocular elevada o con riesgo de glaucoma de ángulo cerrado deben ser controlados cuidadosamente. Los pacientes que presenten exantema, urticaria o alguna reacción alérgica relacionada con la Venlafaxina deben contactar con su médico. (Taketomo, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a Venlafaxina o cualquier componente de la fórmula; uso de inhibidores de la MAO en un lapso de 14 días; no iniciar la administración de un inhibidor de la MAO en el transcurso de siete días después de suspender la venlafaxina. (Taketomo, 2009).

Precauciones: la Venlafaxina debe emplearse con precaución en pacientes con insuficiencia renal o hepática entre moderado y grave, y puede ser necesario realizar un

Durante los inicios del tratamiento antidepresivo, debe haber un control estricto hasta que se observe una mejoría de la depresión, porque el suicidio es un riesgo inherente en los pacientes deprimidos. (Taketomo, 2009).

Como con otros antidepresivos, la Venlafaxina puede dificultar la ejecución de tareas delicadas y, si este fuera el caso, los pacientes afectados no deben conducir ni utilizar maquinaria. Debe avisarse a los pacientes, especialmente a los ancianos, del riesgo de vértigo o inestabilidad debido a la hipotensión ortostática. (Taketomo, 2009).



Los síntomas asociados a una retirada brusca o a una reducción en la dosis de Venlafaxina son fatiga, cefalea, náusea, vómito, mareo, sequedad de boca, diarrea, insomnio, nerviosismo, confusión, parestesia, sudoración y vértigo. Por estos motivos, se recomienda que la Venlafaxina se retire gradualmente durante al menos una semana tras un tratamiento de más de una semana de duración y que se mantenga controlado al paciente para minimizar el riesgo de que aparezcan reacciones de retirada. (Lacy, 2011).

Usar con cautela en pacientes que reciben diuréticos o con depleción de volumen (puede causar hiponatremia o secreción inadecuada de hormona antidiurética; puede causar midriasis. Es posible que ocasione hemorragia anormal (p.ej., equimosis; usar con precaución en pacientes con función plaquetaria anormal. (Taketomo, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

La Venlafaxina no se debe emplear conjuntamente con los IMAO y deben transcurrir 14 días como mínimo entre el cese del tratamiento con IMAO y el inicio del tratamiento con Venlafaxina. Entre la retirada de la Venlafaxina y el inicio con cualquier fármaco capaz de provocar una reacción grave (p.ej., Fenzelina) deben pasar como mínimo 7 días. (Lacy, 2011).

La Cimetidina inhibe el metabolismo hepático de la Venlafaxina, pero no de su metabolito activo, la O-desmetilvenlafaxina, que esta presente en concentraciones mucho mayores en el plasma. En consecuencia, el fabricante recomienda que cuando se administren conjuntamente Cimetidina y Venlafaxina la monitorización clínica puede ser necesaria sólo en ancianos y en pacientes que presenten insuficiencia hepática o hipertensión preexistente. (Lacy, 2011).

La conversión de Venlafaxina en su metabolito con la misma actividad, la O-desmetilvenlafaxina, está mediada por la isoenzima CYP2D6 del citocromo P450. Aunque existen fármacos que inhiben o actúan como sustrato de esta enzima y que pueden afectar potencialmente a las concentraciones plasmáticas de la Venlafaxina y su metabolito activo, los fabricantes consideran que, puesto que la cantidad total de sustancias activas no se ve afectada, no suele ser necesario realizar ajustes de la dosis de la Venlafaxina. (Lacy, 2011).

Antiarrítmicos. Psicosis con el aumento de las concentraciones séricas de Venlafaxina y su metabolito O-desmetilvenlafaxina desarrollado cuando Propafenona terapia se inició en una mujer de 67 años de edad. Hubo una mejora cuando la Venlafaxina fue detenido y reanudarse con una dosis reducida; 50 mg al día es suficiente



para mantener concentraciones terapéuticas en suero. (Lacy, 2011).

Antibacterianos. Hormigueo en la punta de la lengua, parestesia intensa en los dedos, dolor abdominal severo, diarrea profusa, sudor frío y temblando sin control. (Lacy, 2011).

El síndrome serotoninérgico se ha reportado en un paciente anciano tomando Venlafaxina, después de 20 días de tratamiento antibacteriano, incluyendo Linezolid. En otro informe, el síndrome de serotonina desarrollaron 8 días después de comenzar el tratamiento con linezolid por vía intravenosa en un paciente tomando venlafaxina. (Lacy, 2011).

Medicamentos antimigrañosos: Ha habido informes poco frecuentes de la Serotonina síndrome asociado con el uso de la Serotonina y Noradrenalina recaptación de serotonina (IRSN) con la serotonina (5-HT 1) agonistas como sumatriptán. (Lacy, 2011).

Medicamentos del aparato gastrointestinal. Los signos sugestivos de la serotonina síndrome que se produjo después de Metoclopramida intravenosa fueron atribuidos a una interacción con venlafaxine. (Lacy, 2011).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Alteraciones de laboratorio de valor:

Los siguientes han sido seleccionados sobre la base de su potencial significancia clínica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Con la fisiología / valores de las pruebas de laboratorio:

La presión arterial: Relacionada con la dosis hipertensión sostenida, definida como supina mediciones de presión diastólica en tres visitas consecutivas que son 90 mm Hg y que se han multiplicado sobre línea de base por 10 mm de Hg, se ha informado. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

El colesterol, el suero: significa aumentos en las concentraciones de colesterol sérico, de 3 mg/dL de línea base se ha informado, la importancia clínica de este hallazgo no se conoce. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Electrocardiograma (ECG): cambio medio en el intervalo QT corregido [QTc] en 357 pacientes que recibieron la forma de dosificación de liberación prolongada de Venlafaxina fue un aumento de 4,7 milisegundos en comparación con una disminución de 1,9 ms de 285 pacientes tratados con placebo. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Pulso:

La frecuencia cardíaca aumenta de tres a nueve latidos por minuto se han reportado, con un incremento medio de cuatro latidos por minuto. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

EFFECTOS ADVERSOS:

Los efectos adversos de la Venlafaxina que se han notificado con mas frecuencia son nausea, cefalea, insomnio, somnolencia, sequedad de la boca, vértigo, estreñimiento, disfunciones sexuales, astenia, sudores y nerviosismo. Otros efectos adversos son anorexia, dispepsia, dolor abdominal, ansiedad, poliuria, alteraciones visuales, vasodilatación, vomito, temblores, parestesia, escalofríos, palpitaciones, aumento de peso, incremento del colesterol sérico, agitación y prurito cutáneo. También se han notificado convulsiones e incrementos reversibles de las concentraciones de enzimas hepáticas. Ocasionalmente, se han dado casos de hipotensión ortostática. En algunos pacientes, se han observado incrementos de la tensión arterial relacionados con la dosis administrada. Existen notificaciones aisladas de equimosis o trastornos hemorrágicos. Ocasionalmente, se han notificado casos de activación de crisis de manía o de hipomanía. (Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo: **C** (Lacy, 2011).
- Venlafaxina no esta aprobado para uso en pediátricos. Puede ocurrir empeoramiento clínico de la depresión o ideación suicida en niños y adultos con trastorno depresivo mayor. En pruebas clínicas, los antidepresivos aumentaron el riesgo de ideación y conducta suicidas (tendencia suicida) en niños, adolescentes y adultos jóvenes (18 a 24 años) con trastorno de depresión mayor y otras alteraciones psiquiátricas. Debe considerarse este riesgo antes de prescribir antidepresivos para cualquier indicación clínica. Los estudios a corto plazo no mostraron aumento en el riesgo de tendencias suicidas con el uso de antidepresivos en pacientes > 24 años y mostraron una disminución del riesgo en pacientes \geq 65 años.

Los pacientes de todas las edades tratados con antidepresivos por cualquier indicación requieren vigilancia estrecha en busca de agravamiento clínico de la depresión, tendencia suicida y cambios de conducta inusuales, en especial durante los primeros meses del inicio del antidepresivo o cuando se ajusta la dosis. Los pacientes deben vigilarse en busca de conductas relacionadas (p.ej., ansiedad, agitación,



ataques de pánico, insomnio, irritabilidad, hostilidad, agresividad, impulsividad, acatisia, hipomanía, manía), que pueden incrementar el riesgo de agravamiento de la depresión y tendencia suicida. (Taketomo, 2009).

- Evitar su suspensión abrupta; pueden presentarse síntomas de abstinencia (que incluyen agitación, disforia, ansiedad, confusión, mareo, hipomanía, pesadillas y otros síntomas) si el tratamiento se suspende de manera súbita o la dosis se reduce; disminuir paulatinamente la dosis para disminuir el riesgo de síntomas de abstinencia. El riesgo de síntomas de abstinencia puede aumentar con dosis mas altas y duración mas prolongada del tratamiento; para suspender el tratamiento en pacientes que reciben Venlafaxina por > 1 semana, disminuir poco a poco la dosis para minimizar los riesgos de síntomas de abstinencia; para suspender el tratamiento en pacientes que Venlafaxina por \geq 6 semanas disminuir poco a poco la dosis, en por lo menos dos semanas. (Taketomo, 2009).
- La Venlafaxina puede causar aumento sostenido de la presión arterial (dependiente de la dosis; vigilar la presión arterial; puede requerirse reducción o suspensión del fármaco). (Taketomo, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Sobredosis:

Para obtener más información sobre el manejo de sobredosis o ingestión accidental, póngase en contacto con un Centro de Control de Envenenamientos. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Síntomas de la sobredosis:

cansancio extremo o debilidad; parestesia (hormigueo, ardor o picazón sensaciones), convulsiones, taquicardia sinusal (latidos rápidos del corazón), somnolencia, temblores. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Nota: Sólo un pequeño número de casos de sobredosis fueron reportados durante los estudios previos a la comercialización de la Venlafaxina. En la mayoría de estos casos, no se registraron los síntomas. Sin embargo, ha habido informes postcomercialización de muertes que ocurren con sobredosis de Venlafaxina, predominantemente cuando el alcohol u otras drogas fueron ingeridas. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Tratamiento de la sobredosis

No hay un antídoto específico para la Venlafaxina. Tratamiento es esencialmente sintomático y de soporte. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Los cuidados de apoyo:

Asegurar la permeabilidad de la vía aérea adecuada, la oxigenación y la ventilación. Los pacientes en quienes se sabe o se sospecha una sobredosis intencional deben ser referidos para consulta psiquiátrica. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 2987-2990.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 428-429.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1303-1306.



VERAPAMIL

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Verapamilo.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas de liberación prolongada y tableta de liberación inmediata.

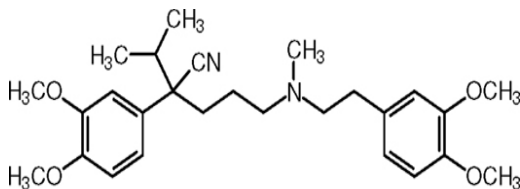
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Hidrocloruro de Verapamilo,
Clorhidrato de iproveratrilo;
Clorhidrato de Verapamilo,
Verapamil; Verapamilo. (Martindale, 2009).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente Antiarrítmico, Clase IV; Antagonista de los canales de calcio; Bloqueador de los canales de calcio; dihidropiridina. (Lacy, 2009).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

El verapamilo es un fenilalquilamina bloqueador de los canales de calcio y un antiarrítmico de clase IV. Se retarda la conducción a través del nodo AV, y por lo tanto disminuye la tasa de aumento de la respuesta ventricular que ocurre en la fibrilación auricular y el flutter. Su lucha contra la angina de pecho se debe principalmente a la vasodilatación coronaria y periférica, aunque también se inhibe el espasmo en la arteria coronaria; la disminución de la resistencia vascular periférica reduce el trabajo del corazón, que tiene un efecto de ahorro en el consumo de oxígeno del miocardio intracelular. La disminución en la resistencia vascular periférica puede También explicar su efecto antihipertensivo. El verapamilo es utilizado en el control de las arritmias supraventriculares y en el manejo de la angina de pecho y la hipertensión. También se pueden utilizar en la en el control de infarto de miocardio. (Martindale, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: inhibe el ingreso del ion calcio a los



conductos lentos o la áreas sensibles al voltaje seleccionadas del musculo liso vascular y el miocardio durante la despolarización; produce relajación del músculo liso vascular coronario y vasodilatación de las arterias coronarias; aunque el aporte de oxígeno a miocardio en pacientes con angina vasoespástica; hace más lenta la automaticidad y conducción del nodo AV.(Lacy, 2009).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:**buena.(Lacy, 2009).
- **Distribución:** Vd: 3.89 L/Kg.(Lacy, 2009).
- **Unión a proteínas:** más o menos 90%.(Lacy, 2009).
- **Vida media:** eliminación: Lactantes: 4.4 a 6.9 h; adultos: dosis única: 3 a 7 h, dosis multiples: 4.5 a 12 h; con disfunción hepática grave: 14 a 16 h.(Lacy, 2009).
- **Metabolismo:** hepático (efecto extenso de primer paso) a través de múltiples isoenzimas de CPY; el metabolito primario es el norverapamilo (con el 20% de la actividad farmacológica del verapamil).(Lacy, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** liberación inmediata: 1 a 2 h.

Liberación prolongada: aproximadamente 11h, la liberación del fármaco se retrasa aproximadamente 4 a 5 h. Liberación sostenida: 5.21 h y 7 a 9 h.(Lacy, 2009).

- **Excreción:** en orina (70% como metabolitos, 3 a 4% como fármacos sin cambios), heces (16%).(Lacy, 2009).

DOSIS:

DOSIS ORAL

Adultos:

Angina de pecho:

Nota: cuando se cambia de un producto de liberación inmediata a uno de liberación prolongada/sostenida, la dosis media total es la misma, a menos que la concentración de la formula no permita una conversión equivalente.

Liberación inmediata: inicial 80 a 120 mg cada 8 h (individuos de edad avanzada o talla breve: 40 mg 3 veces al día); intervalo de dosis usual: 80 a 160 mg en 3 a 4 veces al día.

Liberación prolongada: inicial 180 mg 1 vez al día al acostarse; si la respuesta es inadecuada la dosis se puede aumentar a intervalos semanales hasta 240 mg 1 vez al día, después 360, y a continuación



480 mg 1 vez al día; dosis máxima 480 mg al día.(Lacy, 2009).

Fibrilación auricular crónica (control por la frecuencia) profilaxia de PSVT:

Liberación inmediata: 240 a 480 mg/día 6 a 8 h; intervalo de dosis usual: 120 a 360 mg/día.(Lacy, 2009).

Hipertensión:

Nota: cuando se cambia de una fórmula de liberación inmediata a una de liberación sostenida, la dosis total diaria es la misma, a menos que la concentración de la fórmula no permita una conversión equivalente.

Liberación inmediata: 80 mg cada 8 h; intervalo de dosis usual: 80 a 320 mg/día en 2 dosis divididas.

Liberación sostenida: intervalo de dosis usual: 120 a 480 mg/día en 1 a 2 dosis divididas:

Nota: no hay pruebas de un beneficio adicional con dosis mayores a 360 mg/día.

Liberación prolongada: intervalo de dosis usual: 120 a 360 1 vez al día (se recomienda la dosis 1 vez al día al acostarse).(Lacy, 2009).

Niños:Nota: el verapamilo ya no se incluye en el logaritmo terapéutico de las taquiarritmias del sostén vital pediátrico avanzado (PALS).(Lacy, 2009).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:Hipersensibilidad al verapamilo o cualquier componente de la formulación; disfunción ventricular izquierda grave; hipotensión (presión sistólica < 90mm Hg) o choque cardiogénico; síndrome del seno enfermo (excepto en pacientes con un marcapasos artificial en funcionamiento); bloqueo AV de segundo o tercer grados (excepto en pacientes con un marcapasos artificial funcionando); aleteo o fibrilaciones auriculares y una vía accesoria de derivación.(Lacy, 2009).

Precauciones: evitar su uso en la insuficiencia cardiaca; puede exacerbar el trastorno; está contraindicado en la disfunción ventricular izquierda grave. Se pueden observar incrementos ocasionales de las enzimas hepáticas. Puede causar bloqueo AV de primer grado o bradicardia sinusal.

Tener precaución cuando se usa verapamilo junto con un bloqueador. Usar con cuidado en pacientes con cardiomiopatía hipertrófica y obstrucción de la vía de salida.

Usar con cautela en pacientes con transmisión neuromuscular atenuada (distrofia muscular de Duchenne, miastenia grave); puede requerirse disminución de la dosis. Utilizar con precaución en la disfunción renal; vigilar la hemodinámica y posiblemente el ECG si hay alteración grave, en particular en presencia de disfunción hepática concomitante.



Usar con cautela en pacientes con disfunción hepática; se puede requerir disminución de la dosis, vigilar la hemodinámica y posiblemente el ECG si hay alteración grave. Puede prolongar la recuperación de agentes de bloqueo neuromuscular no despolarizante.(Lacy, 2009).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante de verapamilo con cualquiera de los siguientes: etexilato de dabigatrán; disopiramida; dofetilida; everolimus; ranolazina; tolvaptán; topotecán.(Lacy, 2009).

Aumento del efecto/toxicidad:

verapamilo puede aumentar las concentraciones/efectos de: alcohol (etílico); amifostina; amiodarona; antihipertensivos; atorvastatina; benzodiacepinas (fragmentadas por oxidación); betabloqueadores; buspirona; antagonista de los canales de calcio (dihidropiridínicos); carbamazepina; glucósidos cardiacos; colchicina; corticosteroides (sistémicos); ciclosporina; ciclosporina (sistémica); sustrato de CYP3A4; etexilato de dabigatrán; disopiramida; dofetilida; dronedarona; eletriptán; eplerenona; everolimus; fexofenadina; flecainida; halofantrina; agentes hipotensores; litio; lovastatina; sales de magnesio; midodrina; agentes bloqueadores neuromusculares (no despolarizantes); nitroprusiato;

sustrato de P-glicoproteína; fenitoína; pimecrolimus; quinidina; ranolazina; arroz rojo fermentado; risperidona; rituximab; rivaroxabán; salicilatos; salmeterol; saxagliptina; simvastatina; tacrolimus; tacrolimus (sistémico); tacrolimus (tópico); tolvaptán; topotecán.(Lacy, 2009).

Las concentraciones del verapamilo pueden aumentar por: bloqueadores alfa 1; opioides de tipo anilidopiperidina; agentes antimicóticos (derivados azoles sistémicos); atorvastatina; cimetidina; ciclosporina; ciclosporina (sistémica); inhibidores de CYP3A4 (moderados); inhibidores de CYP3A4 (fuertes); disatinib; diazoxido; dronedarona; everolimus; fluconazol; jugo de toronja; hierbas (con propiedades hipotensoras); antibióticos macrólidos; sales de magnesio; inhibidor de la MAO; pentoxifilina; inhibidores de la p-glicoproteína; inhibidores de la fosfodiesterasa 5; análogos de la protaciclina; inhibidores de la proteasa; quinidina; quinupristina; telitromicina.(Lacy, 2009).

Disminución del efecto:

verapamilo puede disminuir las concentraciones/efectos de: clopidogrel.

Las concentraciones/efectos de verapamilo pueden disminuir por: basbitúricos; sales de calcio; carbamazepina; inductores de CYP3A4 (fuertes); deferasirox; hierbas (inductoras de CYP3A4); hierbas (con propiedades hipertensivas); metilfenidato;



nafcilina; inductores de P-glucoproteína; derivados de la rifamicina; yohimbina.(Lacy, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central: cefalea (con mayor frecuencia), fatiga, mareo, letargo, dolor, trastornos del sueño. (Lacy, 2011).

Cardiovasculares: edema periférico, hipotensión, CHF/edema pulmonar, bloqueo AV, bradicardia, rubor.(Lacy, 2011).

Dermatológicas: exantema.(Lacy, 2011).

Gastrointestinales: hiperplasia gingival, estreñimiento (con mayor frecuencia), dispepsia, náusea, diarrea.(Lacy, 2011).

Hepáticas: aumento de las enzimas hepáticas.(Lacy, 2011).

Neuromusculares y Esqueléticas: mialgias, parestesias.(Lacy, 2011).

Respiratorias: disnea.(Lacy, 2011).

Misceláneo: síndrome tipo influenza.(Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Aunque el verapamilo no se considera un teratógeno humano mayor, su uso durante el embarazo puede causar efectos fetales adversos (bradicardia, bloqueo cardiaco, hipotensión) emplear durante el embarazo solo cuando sea claramente necesario o cuando los beneficios superen al riesgo potencial para el feto. El verapamilo atraviesa la placenta.(Lacy, 2009).

- Lactancia: ingresa a la leche materna/no se recomienda.(Lacy, 2009).
- Factor de riesgo durante el embarazo: **C**.(Lacy, 2009).
- Interacción con alimentos: el jugo de toronja puede aumentar la concentración sérica del verapamil; usar con precaución y vigilar en cuanto a mayores efectos del fármaco.(Lacy, 2009).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Las consecuencias y el tratamiento de la sobredosis con verapamilo son similares a aquellos otros bloqueantes de los canales de calcio, aunque las complicaciones de la muerte y el riesgo de la vida puede ser más común con los no dihidropiridinas tales como el verapamil.(Martindale, 2009).

La sobredosis con preparaciones de liberación modificada de verapamilo



puede dar lugar a toxicidad prolongada de retraso en el inicio. Convencional de liberación preparativos también pueden producir toxicidad prolongada; vida media de eliminación se informó que se prolonga hasta 15 horas y las concentraciones plasmáticas máximas retrasadas de 6 a 7 horas. Aunque la toxicidad severa se relaciona generalmente con una sobredosis aguda verapamilo, síntomas similares también han sido reportados con enfermedades crónicas.(Martindale, 2009).

Tratamiento para la intoxicación:

El carbón activado puede ser administrado por vía oral a los adultos o los niños que presentan dentro de 1 hora de la ingestión de una potencial sobredosis tóxica del medicamento. Alternativamente, lavado gástrico puede ser considerado en los adultos de apoyo y el tratamiento sintomático se debe dar. La hipotensión pueden responder al colocar al paciente en posición supina con los pies elevados; expansores del plasma se puede administrar, a pesar de la sobrecarga cardíaca debe ser evitado. Si la hipotensión no es corregida, el calcio se debe dar por vía intravenosa. La dosis inicial habitual es de 10 a 20 ml de 10% de gluconato de calcio administra por inyección intravenosa lenta o infusión; alternativamente, hasta 10 ml cloruro de calcio al 10% puede ser

dada. El glucagón también puede ser utilizado. Si persiste la hipotensión, por vía intravenosa utilizar simpaticomiméticos tales como la isoprenalina y dopamina, o la noradrenalina también puede ser necesaria. La bradicardia puede ser tratada con atropina, isoprenalina o marcapasos.(Martindale, 2009).

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp.Pp. 1791-1794.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1352, 1421-1425.

WARFARINA SÓDICA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Warfarina Sódica.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas y polvo para inyectable.

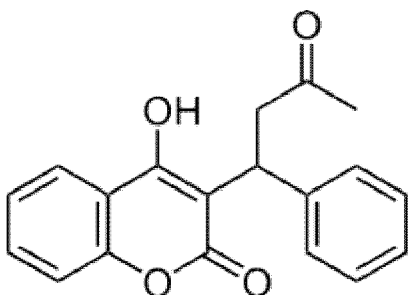
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Warfarina, Warfarina Sódica. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPEÚTICA:

Antagonista de la Vitamina K, anticoagulante derivado de la Cumarina. (Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Profilaxis y tratamiento de trastornos tromboembólicos (por ejemplo venosos, pulmonares) y complicaciones de embolia que surgen de la fibrilación auricular o la

situación de válvulas cardíacas; adyuvante para aminorar el riesgo de embolia sistémica (por ejemplo MI recurrente, apoplejía) después del infarto miocárdico. (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: la síntesis hepática de los factores de coagulación II, VII, IX y X, así como de las proteínas C y S, requieren la presencia de vitamina K. estos factores de coagulación se activan biológicamente por la adición de grupos carboxilo a las fracciones clave de ácido glutámico dentro de la estructura de las proteínas. En el proceso, la vitamina K “activa” se convierte por oxidación a la forma “inactiva”, que después se reactiva por el complejo 1 de la reductasa epóxido de la vitamina K (VKORC1). La Warfarina inhibe de manera competitiva la subunidad 1 del complejo de unidades múltiples VKOR, lo que así consume las reservas de vitamina K funcional y, por tanto, aminora la síntesis de factores de la coagulación activos. (Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:** oral: rápida completa. (Lacy, 2011).



- **Distribución:** 0.14 L/Kg.(Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** 99%.(Lacy, 2011).
- **Vida media, eliminación:** 20 a 60 h; promedio 40 h; muy variable entre individuos.(Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático, sobre todo a través de CYP2C9; las vías menores incluyen CYP2C8, 2C18, 2C19, 1A2, 3A4. Variantes Genómicas: ocurre una disminución de casi 37% de la depuración de S-warfarina en pacientes heterocigotos para 2C9 (*1/*2 o *1/*3), y una disminución de más o menos 70% en pacientes homocigotos para alelos con función reducida (*2/*2, *2/*3, *3/*3).(Lacy, 2011).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** oral: más o menos 4 horas.(Lacy, 2011).
- **Excreción:** en orina (92%, principalmente como metabolitos).(Lacy, 2011).

paciente/tiempo de protrombina normal promedio” basal es de 1 a 1.3): 0.2 mg/Kg (máximo: 10 mg/dosis); ajustar la dosis con base en el INR (rangos comunicados para mantener el INR de 2 a 3: 0.09 a 0.33 mg/Kg/día). Los lactantes menores de 12 meses de edad pueden requerir dosis en el extremo superior de ese rango o cerca; puede ser difícil mantener una anticoagulación constante en niños menores de 5 años de edad.

Adultos: la dosis inicial debe individualizarse. Considerar al paciente (función hepática, función cardíaca, edad, estado nutricional, tratamiento concomitante, riesgo de hemorragia) además de la respuesta a la dosis previa (si está disponible) y la situación clínica. Iniciar con 2 a 5 mg diarios durante 2 días o 5 a 10 mg diarios durante 1 a 2 días. Ajustar la dosis de acuerdo con los resultados de INR; la dosis de mantenimiento usual varía de 2 a 10 mg diarios.(Lacy, 2011).

NOTA: se puede requerir dosis menores de inicio para pacientes con disfunción hepática, nutrición deficiente, CHF, edad avanzada, alto riesgo de hemorragia, aquellos debilitados o que presentan variantes genómicas de función reducida de las enzimas catabólicas CYP2C9 (alelos *2 o *3) o VKORC1 (polimorfismo - 1639). Pueden ser razonables las dosis iniciales más altas en pacientes seleccionados (es decir, que reciben agentes inductores de enzimas y

DOSIS:

DOSIS ORAL

Lactantes y niños: (uso no autorizado): dosis de carga inicial (si el INR “tiempo de protrombina del



tienen bajo riesgo de hemorragia).(Lacy, 2011).

DOSIS INTRAVENOSA:

Adultos: 2 a 5 mg/día administrados en inyección lenta súbita.(Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: Hipersensibilidad a la Warfarina o cualquier componente de la formulación; propensión hemorrágica; cirugía reciente o potencial de ojo o SNC; anestesia por bloqueo regional lumbar o intervención quirúrgica que da como resultado grandes superficies cruentas; discrasias sanguíneas; hipertensión grave no controlada o maligna; pericarditis o derrame pericárdico; endocarditis bacteriana subaguda; antecedente de necrosis inducida por Warfarina; paciente no confiable que no cumple con su esquema; alcoholismos; paciente con antecedente o en riesgo significativo de caídas; paciente senil o psicótico sin supervisión; eclampsia/preclampsia, amenaza de aborto, embarazo.(Lacy, 2011).

Precauciones: tener cuidado en la selección de pacientes apropiados para este tratamiento. Asegurar su cooperación, en especial de aquellos alcohólicos, usuarios de fármacos ilícitos, dementes o psicóticos; la capacidad para cumplir con las pruebas sistemáticas de laboratorio

es crucial. Usar con cautela ante traumatismo, infecciones agudas, insuficiencia renal moderada a grave, insuficiencia alimentaria prolongada, hipertensión moderada a grave, policitemia vera, vasculitis, heridas abiertas, TB activa, cualquier alteración en la flora gastrointestinal normal, antecedentes de PUD, trastornos anafilácticos, catéteres a permanencia, diabetes grave, enfermedad tiroidea y mujeres menstruando y posparto. Usar con precaución en pacientes con trombocitopenia inducida por heparina y DVT. La monoterapia con Warfarina está contraindicada para el tratamiento inicial con HIT. La disminución de la función hepática, sin importar su causa, puede alterar la síntesis de factores de la coagulación y llevar una mayor sensibilidad a la warfarina.(Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Evitar el uso concomitante de Warfarina con tamoxifeno.²

La Warfarina puede aumentar las concentraciones y efectos de anticoagulantes como carvedilol; colagenasa (sistémica); sustratos de CYP2C9 (de alto riesgo); drotrecogina alfa; Fenitoína.(Lacy, 2011).

Aumento del efecto y toxicidad: Las concentraciones y efectos de Warfarina pueden aumentar por:



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Acetaminofén (Paracetamol);
Alopurinol; Amiodarona;
andrógenos; agentes antineoplásicos;
agentes antiplaquetarios; Atazanavir;
Bicalutamida; Capecitabina;
cefalosporinas; Cimetidina;
Clopidrogel; corticosteroides
(sistémicos); Mirtilo; inhibidores de
CYP2C9 (moderados); inhibidores de
CYP2C9 (fuertes); Desatinib;
Desvenlafaxina; Disulfiram;
Dronedarona; Efavirenz; Eritromicina
(oftálmica); Esomeprazol; Etoposido;
Exenatida; Fenofibrato; ácido
Fenofibrato; Fenogreco; derivados del
ácido fíbrico; Fluconazol;
Fluorouracilo; Fluorouracilo
(sistémico); Fluorouracilo (tópico);
Fosamprenavir; Gefitinib; Ginkgo
Biloba; Glucagón; te verde; hierbas
(con propiedades
anticoagulantes/antiplaquetarias);
inhibidores de la reductasa de HMG-
CoA; Fosfamida; Imatinib;
Itraconazol; Ivermectina;
Ketoconazol; Ketoconazol
(sistémico); Lansoprazol;
Leflunomida; antibióticos macrólidos;
Metronidazol; Metronidazol
(sistémico); Miconazol; Milnacipran;
AINE (inhibidores de la COX-2); AINE
(no selectivos); esteroides de
ácido omega-3; Omeprazol; Orlistat;
polisulfato sódico de Pentosano;
Pentoxifilina; fenitoína; posaconazol;
Propafenona; Propoxifeno; análogos
de Prostaciclina; quinidina;
antibióticos de tipo quinolonas;
ranitidina; Salicilatos; inhibidores
selectivos de la recaptación de
Serotonina; Sifaxsentán; Sorafenib;
derivados de sulfonamida;

Tamoxifeno; derivados de
Tetraciclina; agentes Trombolíticos;
productos Tiroideos; Trogociclina;
Tolterodina; Torsemida;
antidepresivos tricíclicos; Venlafaxina;
Vitamina A; Vitamina E; Voriconazol;
Vorinostat; Zafirlukast; Zileuton.
(Lacy, 2011).

Disminución de Efecto: las
concentraciones y efectos de
Warfarina pueden disminuir por:
Aminoglutetimida; agentes
Antineoplásicos, agentes
Antitiroideos; Aprepitant; barbitúricos;
secuestrantes de ácidos biliares;
coenzima Q-10; anticonceptivos
(estrógenos); anticonceptivos
(progéstágenos); inductores de
CYP2C9 (altamente eficaces);
Dicloxacilina; fosfaprepitant;
Gingseng; glutetimida; te verde;
Grinseofulvina; Lopinavir;
Mercaptopurina; Nafcilina;
Peginterferon alfa-2b; Fitonadiona;
derivados de Rifamicina; Ritonavir;
hierba de San Juan; Sucralfato. (Lacy,
2011).

Etanol: la ingestión del alcohol
(sobreindulgente) aminora el
metabolismo de la Warfarina y
aumenta PT/INR. (Lacy, 2011).

EFFECTOS ADVERSOS:

La hemorragia es el principal efecto
adverso de la Warfarina. Puede
ocurrir virtualmente en cualquier sitio.
El riesgo depende de variables
múltiples que incluyen la intensidad

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



de la anticoagulación y la susceptibilidad del paciente.(Lacy, 2011).

Cardiovasculares: angina de pecho, dolor torácico, edema, choque hemorrágico, hipotensión, palidez, síncope, vasculitis.(Lacy, 2011).

Sistema nervioso central: coma, mareo, fatiga, fiebre, cefalea, letargo, malestar general, dolor, apoplejía.(Lacy, 2011).

Dermatológicas: alopecia, erupciones bulosas, dermatitis, exantema, prurito, urticaria.(Lacy, 2011).

Gastrointestinales: cólicos abdominales, dolor abdominal, anorexia, diarrea, flatulencia, hemorragia gastrointestinal, úlceras bucales, náusea, trastornos del gusto, vómito.(Lacy, 2011).

Genitourinarias: hematuria, priapismo.(Lacy, 2011).

Hematológicas: agranulocitosis, anemia, leucopenia, hematoma retroperitoneal, se puede descubrir sitios de hemorragia no detectados antes (por ejemplo cáncer de Colon) por anticoagulación.(Lacy, 2011).

Hepáticas: ictericia colestática, lesión hepática, hepatitis, aumento de transaminasas.(Lacy, 2011).

Neuromusculares y esqueléticas: dolor articular, dolor

muscular, osteoporosis (vinculo potencial con el uso a largo plazo), parálisis, parestesias, debilidad.(Lacy, 2011).

Respiratorias: disnea, calcificación traqueobronquial.(Lacy, 2011).

Misceláneo: reacción anafiláctica, intolerancia al frío, reacciones de hipersensibilidad/alergia, necrosis cutánea, gangrena, síndrome de “dedos púrpura”.(Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo durante el embarazo **X**.(Lacy, 2011).
- Interacción con alimentos: Los efectos anticoagulantes de la Warfarina pueden disminuir si se toma con alimentos ricos en Vitamina K. la vitamina E puede aumentar el efecto de la Warfarina. El jugo de Mirtilo puede aumentar el efecto de la Warfarina.(Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación:

- Heces sanguinolentas, rojas o con aspecto de alquitrán.
- Expectorar o escupir sangre.
- Sangrado abundante con el período menstrual.



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



- Orina de color rosado, rojo o café oscuro.
 - Expectoración o vómito de material con aspecto de posos de café.
 - Aparición de pequeñas manchas rojas, redondas y aplanadas debajo de la piel.
 - Sangrado o hematomas anormales.
 - Eliminación constante de líquido o sangre por las heridas menores.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp. 1425-1433.
 3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1318-1323.

Tratamiento para la intoxicación:

Para reducir o revertir el efecto anticoagulante de la warfarina, que podría presentarse en casos de una intoxicación por una sobredosis o por el uso prolongado del mismo, podemos realizar una o más de las siguientes medidas, de acuerdo a la severidad del sangrado y de la urgencia:

1. Suspender la administración de warfarina.
2. Administrar vitamina K-1.
3. Reemplazar los factores de coagulación dependientes de Vitamina K, con plasma, o concentrados de factores.

REFERENCIAS:

1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexicomp. Pp. 1808-1812.



ZIDOVUDINA

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Zidovudina.

FORMA FARMACEUTICA:

Cápsulas.
Solución oral.
Solución inyectable.

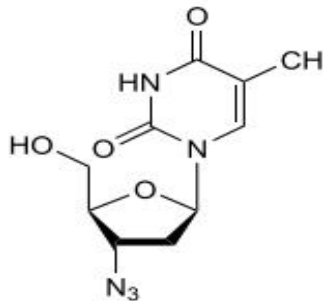
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Azidotimidina; AZT; compuesto S;
ADV. (Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERAPÉUTICA:

Agente antirretroviral inhibidor de la
transcriptasa inversa
(nucleósido).(Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tratamiento de la infección por VIH
en combinación con otros 2 agentes
antirretrovirales; prevención de la
transmisión maternofetal de VIH
como monoterapia.(Lacy, 2011).

La resistencia viral surge rápidamente cuando la Zidovudina se usa sola, por lo general se utiliza con otros antirretrovirales. Puede ser usada solo para prevenir la transmisión vertical de madre al recién nacido si la terapia antirretroviral combinada no está disponible.(Lacy, 2011).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción es un análogo de Timidina que interfiere con la polimerasa de DNA dependiente del RNA de VIH, con el resultado de una inhibición de la replicación viral; inhibidor de la transcriptasa inversa nucleósido.(Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:**
absorción rápida y casi completa en el tracto gastrointestinal tras la administración oral, sin embargo, a causa de primer paso y el metabolismo, la biodisponibilidad sistémica de las cápsulas de Zidovudina y la solución es aproximadamente el 65% (rango, 52 a 75%). biodisponibilidad en los recién nacidos de hasta 14 días de edad es de aproximadamente el 89%, y en los recién nacidos de más de 14 días de edad se reduce a aproximadamente el 61%. administración con una



comida rica en grasas puede disminuir la velocidad y el grado de absorción.(Lacy, 2011).

- **Distribución:** penetración significativa al LCR; atraviesa la placenta.(Lacy, 2011).
- **Unión a proteínas:** 25 a 38%.(Lacy, 2011).
- **Vida media:** eliminación: terminal: 0.5 a 3h.(Lacy, 2011).
- **Metabolismo:** hepático por glucuronización hasta metabolitos inactivos; efecto extenso de primer paso.(Lacy, 2011).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** 30 a 90 min.(Lacy, 2011).
- **Excreción:**
Oral: orina (72 a 74% como metabolitos, 14 a 18% como fármaco sin cambios).
IV: orina(45 a 60% como metabolitos, 18 a 29% como fármacos sin cambios).(Lacy, 2011).

DOSIS:

DOSIS ORAL:

Para la prevención de la transmisión maternofetal de VIH, considerar el uso de Zidovudina en combinación con Nevirapina en situaciones seleccionadas.

Lactantes de término: 2 mg/Kg/dosis cada 6 horas.

Lactantes mayores o igual a las 30 semanas y menores a las 35 semanas de gestación al nacer: 2 mg/Kg/dosis cada 12 horas; a las 2 semanas de edad, aumentar a 2 mg/Kg/dosis cada 8 horas.

Lactantes menores a las 30 semanas de gestación al nacer: 2 mg/Kg/dosis cada 12 horas; a las 4 semanas de edad aumentar a 2 mg/Kg/dosis cada 8 horas.

Materna: 100 mg 5 veces al día o 200 mg 3 veces al día, o 300 mg cada 12 horas. Iniciar a las 14 a 34 semanas de gestación y continuar hasta el principio del trabajo del parto.(Lacy, 2011).

DOSIS IV:

Para la prevención de la transmisión maternofetal de VIH:

Lactantes que no pueden recibir dosificación oral:

De término: 1.5 mg/Kg/dosis cada 6 horas.

Lactantes mayores o igual a 30 semanas y menores a 35 semanas de gestación al nacer: 1.5 mg/Kg/dosis cada 12 horas; a las 2 semanas de edad, aumentar a 1.5 mg/Kg/dosis cada 8 horas.

Lactantes menores a 30 semanas de gestación al nacer: 1.5 mg/Kg/dosis cada 12 horas; a las 4 semanas de edad aumentar a 1.5 mg/Kg/dosis cada 8 horas.

Materna: durante el trabajo de parto suministrar Zidovudina a razón de 2 mg/Kg IV continua de 1 mg/Kg/hora



hasta el pinzamiento del cordón umbilical.(Lacy, 2011).

Tratamiento de la infección por VIH:

DOSIS ORAL:

Niños: de 4 semanas a menores de 18 años: la dosis debe calcularse por peso corporal (en Kg) o superficie corporal, sin rebasar la recomendada para el adulto.

Dosis basada en la superficie corporal: 240 mg/m² cada 12 horas (máximo 300 mg cada 12 horas) o 160 mg/m²/dosis cada 8 horas (máximo 200 mg cada 8 horas).

Dosis basada en el peso: de 4 a menos de 9 Kg: 12 mg/Kg/dosis cada 12 horas u 8 mg/Kg/dosis cada 8 horas.

Peso entre, mayor o igual 9 Kg y menor a 30 Kg: 9 mg/Kg/dosis cada 12 horas o 6 mg/Kg/dosis cada 8 horas.

Peso mayor o igual a 30 Kg: 300 mg cada 12 horas o 200 mg cada 8 horas.

Adultos: 300 mg cada 12 horas o 200 mg cada 8 horas.(Lacy, 2011).

DOSIS IV

Niños: de 6 semanas a menores de 12 años.

Infusión IV continua: 20 mg/m²/hora.

Infusión IV intermitente: 120 mg/m²/dosis cada 6 horas.

Niños: mayores o igual a los 12 años.

Infusión IV intermitente: 1 mg/Kg/dosis cada 4 horas en el transcurso del día (5 a 6 dosis/día).

Adultos: 1 mg/Kg/dosis, administradas cada 4 horas en el transcurso del día (5 a 6 dosis/día).(Lacy, 2011).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones: Hipersensibilidad a la Zidovudina o cualquier componente de la formulación que ponga en riesgo la vida.(Lacy, 2011).

Usar con cautela en pacientes con afección de la médula ósea (granulocitos < 1000 células/mm³ o hemoglobina < 9.5 mg/dL); se puede requerir ajuste de la dosis en pacientes que presentan anemia o neutropenia.(Lacy, 2011).

Precauciones: Se han comunicado acidosis láctica y hepatomegalia grave con esteatosis; usar con cuidado en pacientes con factores de riesgo de hepatopatía (el riesgo se puede estar aumentando en aquellos con obesidad o exposición prolongada). Tener precaución cuando se usa en combinación con interferón alfa, con o sin Ribavirina, en pacientes infectados por VIH/HBV.(Lacy, 2011).

Su uso prolongado se ha vinculado con miopatía sintomática y miositis. Puede causar redistribución de la grasa (por ejemplo giba de búfalo, consumo periférico con aumento de la cintura abdominal, aspecto cushingoides). Disminuir la dosis en



pacientes con disfunción renal grave.(Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

Las siguientes interacciones con drogas y / o problemas relacionados han sido seleccionados sobre la base de su potencial significancia clínica, combinaciones que contengan cualquiera de los siguientes medicamentos, dependiendo de la cantidad presente, también puede interactuar con este medicamento.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Radioterapia: el uso concurrente de estos medicamentos y la terapia de radiación con Zidovudina puede causar un efecto aditivo o sinérgico de mielosupresión, la reducción de la dosis puede ser requerida.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Claritromicina: primeros resultados del estudio de dosis escalada de los pacientes infectados por el VIH-mostraron que el uso concomitante de Zidovudina y Claritromicina resultó en una menor concentración sérica máxima (C max), una menor área bajo la curva concentración-tiempo, y el tiempo de retraso a la concentración máxima (T max) de Zidovudina.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Fluconazol: el uso concomitante de Fluconazol interfiere con un aclaramiento de Zidovudina y el

metabolismo, el aumento de área de Zidovudina en el plasma curva tiempo-concentración en un 74% (rango de 28 a 173%) y Zidovudina vida media de un 128% (rango de 4 a 189%).(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Ganciclovir: el uso concomitante con Zidovudina ha causado toxicidad hematológica severa, incluso cuando la dosis de Zidovudina fue reducida a 300 mg por día; este efecto se cree que es el resultado de la toxicidad sinérgica mielosupresor en lugar de una interacción farmacocinética, la administración simultánea se debe usar con extrema precaución , los parámetros hematológicos, como la hemoglobina, hematocrito y el recuento de glóbulos blancos con diferencial deben ser monitoreados con frecuencia en todos los pacientes que reciben tratamiento con Zidovudina y Ganciclovir.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Interferón-Alfa: toxicidad hematológica puede ocurrir con el uso concomitante; reducción de la dosis o la interrupción de uno o ambos de los medicamentos puede ser necesario: parámetros hematológicas, como la hemoglobina, el hematocrito y el recuento de glóbulos blancos con diferencial deben ser monitoreados con frecuencia en todos los pacientes recibir el tratamiento con Zidovudina e interferón-alfa.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Fenitoína: ha habido varios informes de la disminución de las concentraciones plasmáticas de Fenitoína, y un caso de aumento de la concentración plasmática de Fenitoína, con el uso concomitante, sin embargo, un estudio de interacción farmacocinética no mostró ningún efecto sobre la cinética de la Fenitoína, pero una disminución del 30% en el despacho de la Zidovudina se observó con el uso concurrente.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Metadona: el uso concomitante puede aumentar el área bajo la curva de Zidovudina curva tiempo-concentración.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Lamivudina: el uso concomitante puede aumentar la concentración plasmática máxima de Zidovudina, sin embargo, el área bajo la curva concentración-tiempo y el aclaramiento total de Zidovudina no se alteró significativamente.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Rifampicina: el uso concomitante puede disminuir el área bajo la curva de concentración de Zidovudina en plasma.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Probenecid: el uso concurrente inhibe la secreción y glucuronidación de Zidovudina a través de los túbulos renales, dando como resultado un incremento de la concentración en el suero y una

prolongada vida media de eliminación, lo que puede aumentar el riesgo de toxicidad, o posiblemente permitir una reducción en la dosis diaria Zidovudina, sin embargo, en un pequeño ensayo, una incidencia muy alta de la erupción se observó en pacientes que reciben Probenecid simultáneamente con Zidovudina, similares a la influenza sintomatérmico.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Estavudina: los estudios in vitro han detectado un efecto antagonista antiviral entre Estavudina y Zidovudina en una relación molar de 20 a 1, respectivamente; el uso concurrente no se recomienda hasta que en estudios in vivo que demuestran que estos medicamentos no son antagonistas en su actividad anti-VIH.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Ácido Valproico: puede aumentar la biodisponibilidad oral de Zidovudina al interferir con el metabolismo de primer paso de Zidovudina; un aumento del área bajo la Zidovudina plasma curva tiempo-concentración de 79% + / - 61% y una disminución en el plasma de 22% + / - 10% se observó con el uso concomitante; los pacientes que toman ambos medicamentos deben ser monitorizados para detectar un posible aumento de la Zidovudina en la farmacocinética de Ácido Valproico no ha sido evaluado.(Lacy, 2011).

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



EFFECTOS ADVERSOS:

Gastrointestinales: estreñimiento, náusea, anorexia, vómito, cólicos abdominales, dolor abdominal, dispepsia, disfagia, flatulencia, úlcera bucal, pigmentación de la mucosa oral, pancreatitis, disgeusia.(Lacy, 2011).

Cardiovasculares: cardiomiopatía, dolor torácico, síncope, vasculitis.(Lacy, 2011).

Sistema Nervioso Central: cefalea, malestar general, ansiedad, escalofríos, confusión, depresión, mareo, fatiga, insomnio, pérdida de la agudeza mental, manía, convulsiones, somnolencia, vértigo.(Lacy, 2011).

Dermatológicas: prurito, exantema, cambios de pigmentación de piel/uñas, síndrome de Stevens-Johnson, necrólisis epidérmica tóxica, urticaria.(Lacy, 2011).

Endocrinas y metabólicas: redistribución de la grasa corporal, ginecomastia.(Lacy, 2011).

Genitourinarias: frecuencia urinaria, disuria inicial.(Lacy, 2011).

Hematológicas: anemia aplásica, anemia hemolítica, leucopenia, linfadenopatía, pancitopenia con hipoplasia de médula ósea, aplasia eritrocítica pura.(Lacy, 2011).

Hepáticas: con más frecuencia aumento de transaminasas, en menor frecuencia hepatitis, hepatomegalia con esteatosis,

hiperbilirrubinemia, ictericia, acidosis láctica.(Lacy, 2011).

Neuromusculares y Esqueléticas: artralgias, dolor dorsal, aumento de CPK, aumento de LDH, dolor musculoesquelético, mialgias, neuropatía, espasmos, miopatía, miositis, parestesias, rabdomiólisis, escalofríos con temblor.(Lacy, 2011).

Oculares: ambliopía, edema macular, fotofobia.(Lacy, 2011).

Óticas: pérdida de la audición.(Lacy, 2011).

Respiratorias: tos, disnea, rinitis, sinusitis.(Lacy, 2011).

Misceláneo: Reacciones alérgicas, anafilaxia, angioedema, diaforesis, síndrome tipo influenza, síndrome de reconstitución inmunitaria.(Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

- Factor de riesgo para el embarazo: **C**.(Lacy, 2011).
- Lactancia: ingresa a leche materna por lo tanto está contraindicada.(Lacy, 2011).
- Se puede tomar sin considerar las comidas.(Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación: toxicidad en la médula estrecha,



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



específicamente anemia, leucopenia, trombocitopenia (palidez, cansancio o debilidad inusual, fiebre, escalofríos o dolor de garganta, aumento de sangrado o moretones), alteraciones gastrointestinales (náuseas y vómitos), neurotoxicidad, específicamente ataxia, fatiga, letargia, nistagmus, convulsiones (la falta de Coordinación; involuntario movimiento rápido y rítmico de los ojos, convulsiones) .¹

(19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1819-1821.

Tratamiento para la intoxicación:

en el tratamiento para sobredosis o intoxicación por zidovudina se menciona que no se elimina de la sangre por diálisis peritoneal o hemodiálisis, cantidades insuficientes para justificar el uso de diálisis en una situación de sobredosis.¹

- Monitorear al paciente para la prueba de la neurotoxicidad y la supresión de la médula ósea.
- Atención de apoyo o terapia de apoyo: pacientes en los que se sabe o se sospecha una sobredosis intencional deben ser referidos para consulta psiquiátrica.¹

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 3046-3051.
2. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica.

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



ZINC

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Zinc.

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas.

NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Zinc.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

CATEGORÍA FARMACOTERA- PÉUTICA:

Suplemento nutricional.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INDICACIONES:

Suplementos de Zinc se indican en la prevención y tratamiento de deficiencia de Zinc, lo que puede resultar de una nutrición inadecuada o malabsorción intestinal y otras condiciones que interfieren con la utilización de Zinc o las pérdidas. El aumento de Zinc en el cuerpo, pero no se produce en individuos sanos que recibieron una dieta equilibrada adecuada. Para la profilaxis de la deficiencia de Zinc, mejora de la dieta, en lugar de suplementos, es aconsejable. Para el tratamiento de la

deficiencia de Zinc, la suplementación es el preferido.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

La deficiencia de Zinc puede dar lugar a un retraso del crecimiento, hipogonadismo en los varones, la anorexia (posiblemente debido a cambios en el gusto y el olfato), depresión de la función mental, dermatitis, alteración de la cicatrización de heridas, supresión de la función inmune, la diarrea, y anormal metabolismo de Vitamina A anormales del metabolismo con deterioro de la visión en la noche.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: suplemento nutricional zinc es necesaria para el correcto funcionamiento de más de 200 metaloenzimas, incluyendo anhidrasa carbónica, carboxipeptidasa A la alcohol deshidrogenasa, fosfatasa alcalina, y la ARN polimerasa. También se requiere para mantener la estructura en los ácidos nucleicos, proteínas, y las membranas celulares. Funciones fisiológicas que son dependientes de zinc se encuentran el crecimiento y la división celular, la maduración sexual y la reproducción, adaptación a la oscuridad y la visión nocturna,



cicatrización de heridas, inmunidad de acogida, la agudeza del gusto, y la agudeza olfatoria posiblemente.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Health Care Professional USP DI, 2007).

DOSIS:

FARMACOCINÉTICA:

DOSIS ORAL

Suplemento vitamínico: 1 tableta cada 12 horas por 3 semanasmínimo

- **Absorción:**

Aproximadamente 20 a 30% de cinc en la dieta se absorbe, principalmente desde el duodeno y el íleon. La cantidad absorbida depende de la biodisponibilidad de los alimentos.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Embarazo y Lactancia: 1 tableta diaria durante su estadio.

Trastornos del Zinc: 1 tableta diaria durante 6 semanas.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

- **Unión a proteínas:** el zinc es 60% unido a la albúmina; 30 a 40% a las alfa-2 macroglobulina o transferrina, y 1% de unión a los aminoácidos, principalmente histidina y cisteína.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Precauciones:

Embarazo / Reproducción: el embarazo los problemas en los seres humanos no se han documentado con la ingesta de cantidades recomendadas diarias normales. Sin embargo, estudios adecuados y bien controlados en seres humanos no se han realizado. FDA embarazocategoría C. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

- **Almacenamiento:** de zinc se almacena principalmente en los glóbulos rojos y blancos, sino también en el músculo, hueso, piel, riñón, hígado, páncreas, la retina, y de la próstata.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

En pacientes geriátricoslos problemas de la geriatría no se han documentado con la ingesta normal de las cantidades diarias recomendadas. Los ancianos pueden estar en riesgo de deficiencia de Zinc debido a la selección de alimentos pobres, la disminución de la absorción intestinal de Zinc, o los

- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** aproximadamente en 2 horas.(Drug Information for the



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos

CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



medicamentos que pueden disminuir la absorción o aumentar la pérdida urinaria de Zinc.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:

NOTA: Las combinaciones que contengan cualquiera de los siguientes, dependiendo de la cantidad presente, pueden también interactuar con los suplementos de Zinc:

Suplementos de Cobre: dosis grandes de Zinc pueden inhibir la absorción de cobre en el intestino, los suplementos de Zinc deben tomarse al menos 2 horas después de la administración de suplementos de cobre.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Diuréticos Tiazidicos: Diuréticos Tiazídicos se han encontrado para aumentar la excreción urinaria de zinc.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Fibra, que se encuentra en el salvado, los panes integrales y cereales o alimentos que contienen fósforo, tales como la leche o aves de corral o los fitatos, que se encuentran en el salvado y los panes integrales y los cereales: el uso concomitante de grandes cantidades de fibra, fósforo, o fitatos con suplementos de Zinc pueden

reducir la absorción de Zinc por formación de complejos no absorbibles; los alimentos que contienen fibra, fósforo, o fitatos se deben tomar al menos 2 horas después de los suplementos de zinc.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Ácido fólico: algunos estudios han encontrado que el ácido fólico puede reducir la absorción de Zinc, pero no en la presencia de Zinc excesivos, otros estudios no han encontrado ninguna inhibición.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Suplementos de hierro, por vía oral: grandes dosis de suplementos de hierro puede inhibir la absorción intestinal de Zinc, lo que, al mismo tiempo, era un problema en las personas que toman multivitminicos y minerales comerciales preparados o fórmulas infantiles que tenían un alto contenido de hierro a la relación de Zinc.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

Penicilamina, y quelantes de metales pesados: posiblemente otros el uso concomitante puede disminuir la absorción de Zinc, un período de 2 horas deben transcurrir entre la administración de Penicilamina y el Zinc.(Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Recuerda que siempre es necesario consultar al médico antes de su consumo, ya sea en cápsulas o pastillas. Esto se debe a que en ocasiones los suplementos alimenticios dicen contener un nutriente y en realidad contienen otros, por eso es sumamente importante asegurarse que sea 100% natural y 100% Zinc.

- Lactancia: problemas en los seres humanos no se han documentado con la ingesta de cantidades recomendadas diarias normales. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

REFERENCIAS:

1. (2007). Drug Information for the Health Care Professional USP DI Vol. I (27 edición). Estados Unidos: Editorial Massachusetts Micromedex. Pp. 18.

ZOLPIDEM TARTRATO

NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO:

Zolpidem

FORMA FARMACEUTICA:

Tabletas de liberación prolongada.
Tabletas de liberación inmediata.

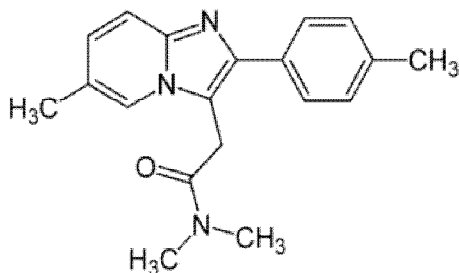
NOMBRE QUÍMICO Y/O SINONIMO:

Tartrato de Zolpidem.(Lacy, 2011).

CATEGORÍA FARMACOTERA- PÉUTICA:

Hipnótico no benzodiazepinico.(Lacy, 2011).

ESTRUCTURA QUÍMICA:



Fuente: Martindale, 2009.

INDICACIONES:

Tabletas de liberación inmediata, tabletas sublinguales: tratamiento a corto plazo del insomnio (dificultad para conciliar el sueño). (Taketomo, 2009).

Tabletas de liberación prolongada: tratamiento del insomnio (dificultad para conciliar el sueño o mantenerse dormido). (Taketomo, 2009).

FARMACODINAMIA:

Mecanismo de acción: el Zolpidem es un hipnótico de tipo Imidazolpiridina que es estructuralmente diferente de la benzodiazepinas, aumenta la actividad del neurotransmisor inhibitorio, ácido gama-aminobutirico (GABA) por agonismo selectivo en el receptor 1 de benzodiazepinas (BZ1); el resultado es un aumento de la conductancia del cloro, hiperpolarización neuronal, inhibición del potencial de acción y decremento de la excitabilidad neuronal que llevan a sus efectos sedantes e hipnóticos.(Lacy, 2011).

FARMACOCINÉTICA:

- **Absorción:**
Se absorbe rápidamente en el tubo digestivo. (Martindale, 2009).
- **Distribución:** entra a la leche materna con un Vd aparente de: niños de 2 a 6 años: 1.8 ± 0.8 L/Kg, niños de 6 a 12 años: 2.2 ± 1.7 L/Kg, adolescentes: 1.2 ± 0.4 L/Kg, adultos: 0.54 L/Kg.(Taketomo, 2009).



- **Unión a proteínas:** y se une a las proteínas plasmáticas en un 92%. (Martindale, 2009).
- **Vida media:** tiene una semivida de eliminación de unas 2.5 horas. (Martindale, 2009).
- **Metabolismo:** experimenta un metabolismo de primer paso y se ha registrado una biodisponibilidad absoluta aproximadamente del 70%. Se metaboliza principalmente por la isoenzima CYP3A4 del citocromo P450. (Martindale, 2009).
- **Tiempo hasta alcanzar la concentración sérica máxima:** la concentración plasmática máxima se alcanza en menos de 3 horas. (Martindale, 2009).

DOSIS:

DOSIS ORAL

Adultos: producto de liberación prolongada, sublingual: 10 mg justo antes de acostarse; dosis máxima: 10 mg.
Producto de liberación prolongada: 12.5 mg justo antes de irse a la cama. (Lacy, 2011).

Ancianos: producto de liberación inmediata, sublingual: 5 mg justo antes de acostarse.
Producto de liberación prolongada: 6.25 mg justo antes de

acostarse. (Drug Information for the Health Care Professional USP DI, 2007).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES:

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad al Zolpidem o cualquier componente de la formulación. (Lacy, 2011).

Precauciones: en pacientes con miastenia grave y en los de edad avanzada; se recomienda ajustar la dosis. Vigilar de cerca a los individuos de edad avanzada o debilitados en cuanto a alteraciones de su desempeño cognitivo o motor. Evitar usarlo en pacientes con apnea del sueño o antecedente de abuso de sedantes/hipnóticos. Se ha observado también un mayor riesgo de actividades peligrosas relacionadas con el sueño, como quedarse dormido al conducir un automóvil, preparar o comer alimentos y realizar llamadas telefónicas; también puede ocurrir amnesia. (Lacy, 2011).

Usar con precaución ante enfermedades respiratorias. Emplear con cuidado con la disfunción hepática; se requiere ajustar de la dosis. No se ha establecido la seguridad y eficacia en pacientes pediátricos. (Lacy, 2011).

INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS:



Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos

CEGIMED

Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia

UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



Antidepresivos: Se presentó un caso en el que una joven de 16 años que había estado tomando 20 mg/día de Paroxetina durante 3 días empezó a sufrir alucinaciones y a desorientarse 1 hora después de tomar 10 mg de Zolpidem por la noche. El delirio remitió espontáneamente tras permanecer 4 horas sin tratamiento. El estudio de otros pacientes también tratados con esta combinación demostró que sufrían alucinaciones visuales transitorias. Se han registrado otros casos aislados de alucinaciones visuales en pacientes que toman Zolpidem junto con antidepresivos como Bupropión, Desipramina, Fluxetina, Sertralina y Venlafaxina. (Martindale, 2009).

Antimicóticos: El empleo de Ketoconazol con Zolpidem ha producido un incremento de la concentración plasmática y un aumento de los efectos sedantes del Zolpidem, aunque solo de forma leve. La administración conjunta de Zolpidem y Fluconazol o Itraconazol ha dado como resultado pequeños cambios aunque no significativos, en la farmacocinética y en los efectos sedantes del Zolpidem. (Martindale, 2009).

Antivíricos: Los inhibidores de la proteasa del VIH como Ritonavir pueden incrementar la concentración plasmática de Zolpidem, con riesgo de sedación extrema y depresión respiratoria; la administración conjunta no está recomendada. (Martindale, 2009).

Rifampicina: Redujo los efectos hipnóticos del Zolpidem en un estudio en 8 mujeres sanas. El área bajo la curva del Zolpidem se redujo en un 73% tras la administración de Rifampicina y la concentración plasmática máxima en un 58%. La semivida de eliminación del Zolpidem se redujo de 2.5 a 1.6 horas. Cabía esperar efectos similares con otros potentes inductores de la isoenzima CYP3A4 del citocromo P450, como la carbamazepina o la Fenitoína. (Martindale, 2009).

INTERFERENCIAS ANALÍTICAS:

Aumento de aminotrasferasas, bilirrubinas. (Martindale, 2009).

Disminución en la captación de RAI. (Martindale, 2009).

EFFECTOS ADVERSOS:

Sistema nervioso central: mareo, cefalea, somnolencia (mayor al 10%), sueños anormales, ansiedad, apatía, amnesia, ataxia, trastornos de la atención, aumento de la temperatura corporal, confusión, despersonalización, depresión, desinhibición, desorientación, mareo, sensación de intoxicación, sensación de estar bajo efecto de drogas, euforia, fatiga, fiebre, alucinaciones, hipoestesias, insomnio, letargo, trastorno de la memoria, estrés, cambios de talante. (Lacy, 2011).

3ª Calle 6-47 Zona 1- Antiguo Edificio Facultad de Farmacia. 01001. Guatemala.

Teléfonos: 2230-0184—2230-0539. Telefax: 2253-9905

cegimed@intenet.com

www.cegimed.org



Dermatológicas: exantema, urticarias, arrugas.(Lacy, 2011).

Endocrinas y Metabólicas: menorragia.(Lacy, 2011).

Gastrointestinales: malestar, dolor e hipersensibilidad abdominales, trastorno del apetito, estreñimiento, diarrea, dispesia, flatulencia, gastroenteritis, reflujo gastroesofágico, hipo, náusea, vómito, xerostomía.(Lacy, 2011).

Genitourinarias: infección de las vías urinarias.(Lacy, 2011).

Neuromusculares y Esqueléticas: artralgias, dolor dorsal, trastorno del equilibrio, mialgias, dolor del cuello, parestesias, retardo psicomotor, escalofríos con temblor, debilidad.(Lacy, 2011).

Oculares: astenopia, visión borrosa, alteración de la percepción de profundidad, diplopía, ojo rojo, trastornos visuales.(Lacy, 2011).

Óticas: laberintitis, acúfenos, vértigo.(Lacy, 2011).

Renales: disuria.(Lacy, 2011).

Respiratorias: faringitis, sinusitis, irritación faríngea, infección de vías urinarias altas.(Lacy, 2011).

Misceláneo: alergia, sobreindulgencia en la alimentación, síndrome tipo influenza.(Lacy, 2011).

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Debe usarse solo después de la valoración de las causas potenciales del trastorno del sueño. Los hipnóticos/sedantes se han vinculado con pensamientos anormales y cambios de conducta que incluyen menor inhibición, agresividad, conducta irregular, agitación, alucinaciones y despersonalización. Los sedantes/hipnóticos pueden producir síntomas de abstinencia después de su interrupción. Usar con precaución en pacientes con depresión; se ha comunicado empeoramiento de la depresión, que incluye ideas suicidas o el suicidio, con el uso de hipnóticos.(Lacy, 2011).

- Factor de riesgo durante el embarazo: **C**.(Lacy, 2011).

INTOXICACIÓN Y SU TRATAMIENTO:

Síntomas de intoxicación:

Los síntomas de sobredosis aguda o intoxicación pueden incluir: somnolencia, confusión, respiración superficial, sensación de desmayo, desmayos, vómito, agitación, torpeza en el habla, problemas para ponerse de pie o caminar, alucinaciones (ver u oír cosas que no existen), coma.

Tratamiento para la intoxicación:

En casos de sobredosis es conveniente tomar las medidas



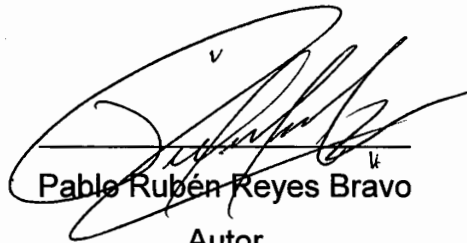
Centro Guatemalteco de Información de Medicamentos
CEGIMED
Facultad de Ciencias Químicas y Farmacia
UNIVERSIDAD DE SAN CARLOS DE GUATEMALA



habituales de precaución como acudir a un centro especializado, vigilancia de los parámetros cardio-respiratorios, perfusión de soluciones adecuadas si es necesario. En caso de una ingestión menor a 1 hora inducir el vómito si la persona está consciente, o en su defecto, un lavado gástrico con protección de las vías aéreas. Pasado ese período, la administración de carbón activado puede reducir la absorción.

REFERENCIAS:

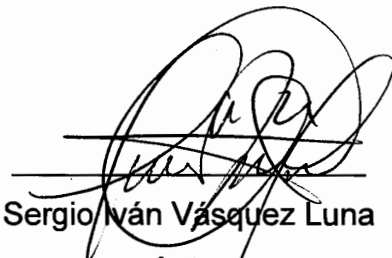
1. Lacy, Charles F. et.al. (2011). Manual de Prescripción Médica. (19a Edición). México: Editorial Inter. Sistemas Lexi comp. Pp. 1827-1829.
2. Martindale. (2009). The Complete Drug Reference (36 Edición). Inglaterra: Pharmaceutical Press. Pp.1037-1038.
3. Taketomo, C. y Hodding, J. (2009). Manual de Prescripción Pediátrica (15ª Edición). México: Editorial Inter Sistemas. Lexi Comp. Pp. 1335-1337.



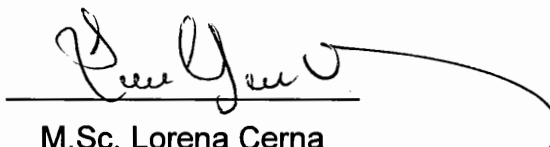
Pablo Rubén Reyes Bravo
Autor




Byron Raúl Mazariegos Chávez
Autor



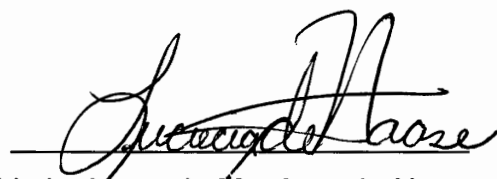
Sergio Iván Vásquez Luna
Autor




M.Sc. Lorena Cerna
Asesora



Licda. Alba de Torres
Revisora



Licda. Lucrecia Martínez de Haase
Directora de Escuela de Química Farmacéutica



Dr. Oscar Cobar Pinto
Decano