



CORPORACIÓN UNIVERSITARIA  
**RAFAEL NÚÑEZ**  
PARA QUE TU DESARROLLO CONTINÚE SU MARCHA

---

# GUÍA DE LABORATORIO FARMACOLOGÍA. IV SEMESTRE

Sergio Uribe Merlano, QF, MSc.  
Neyder Contreras Puentes, QF, MSc

---

Facultad de Ciencias de la Salud  
Programa de Medicina





©Corporación Universitaria Rafael Núñez  
Institución Universitaria | Vigilada Mineducación  
2020.  
Hecho en Colombia

**Rector**

Miguel Ángel Henríquez López

**Vicerrector General**

Miguel Henríquez Emiliani

**Vicerrectora Académica**

Patricia De Moya Carazo

**Vicerrector Administrativo y Financiero**

Nicolás Arrázola Merlano

**Directora Institucional de la Calidad**

Rosario López Guerrero

**Directora de Investigación**

Judith Herrera Hernández

**Director programa de Medicina**

Heliana Padilla Santos

Mónica Rocha Carrascal

**Director de Biblioteca Miguel Henríquez Castañeda-Cartagena**

Luis Fernando Rodríguez L.

**Revisión técnica disciplinar**

Heliana María Padilla Santos

**Revisión y corrección de estilo**

Edmundo Altamiranda Baldiris

Emilia Palomino Nieves

**Autor**

Sergio Uribe Merlano

Neyder Contreras Puentes



## TABLA DE CONTENIDO

PRESENTACIÓN GENERAL.....	4
NORMAS GENERALES DE BIOSEGURIDAD EN EL LABORATORIO .....	5
PLAN DE TRABAJO DEL ESTUDIANTE.....	6
PRÁCTICA N° 1: BÚSQUEDA BIBLIOGRAFICA .....	7
PRÁCTICA N 2 FORMAS FARMACÉUTICAS .....	11
PRACTICA N° 3 DISOLUCIÓN Y DESINTEGRACIÓN DE FORMAS FARMACÉUTICAS SÓLIDAS ORALES .....	19
PRACTICA N° 4 CÁLCULO DE DOSIS.....	22
PRACTICA N° 5 VÍAS DE ADMINISTRACIÓN .....	27
PRACTICA N° 6 FARMACODINAMIA .....	35
PRACTICA N° 7 FARMACOS DEL SISTEMA NERVIOSO AUTÓNOMO.....	38
PRACTICA N° 8 ANTIHIPERTENSIVOS .....	43
PRACTICA N° 9 MANEJO DE ANTICOAGULANTES Y ANTIAGREGANTES PLAQUETARIOS .....	47
PRACTICA N° 10 MANEJO DE INSULINA.....	51
PRÁCTICA N° 11 FÁRMACOS ANTIEMÉTICOS .....	55
PRACTICA N° 12 ANTIHISTAMÍNICOS.....	60
PRACTICA N° 13 ANALGÉSICOS ANTIINFLAMATORIOS NO ESTEROIDEOS.....	65
PRACTICA N°14 HIPNÓTICOS y SEDANTES .....	69
PRACTICA N° 15 ANTIBIÓTICOS.....	73
PRACTICA No 16 FARMACOVIGILANCIA.....	78
BIBLIOGRAFIA.....	81.



## **PRESENTACIÓN GENERAL**

La farmacología es la disciplina encargada de estudiar la interacción entre los medicamentos y un organismo vivo. Esta es útil en el campo de la medicina como una herramienta para tratar, diagnosticar y prevenir enfermedades, convirtiéndose en una de las asignaturas más significativas que los estudiantes de Ciencias de la Salud deben conocer en su formación académica, caracterizándose por integrar distintas áreas del conocimiento como Química, Biología molecular, Fisiología, Anatomía, Fisiopatología, Estadística, entre otras y convirtiéndola en una rama valiosa para comprender mediante un abordaje profundo las bases racionales de la terapéutica, ayudando a explicar el porqué, cuándo y cómo, de la utilización de los Fármacos.

Por tal motivo, la relación entre farmacología y medicina es esencial para introducir en la terapéutica a estudiantes y médicos. De igual manera, interpretar de forma correcta los avances en materia de nuevos efectos de compuestos terapéuticos conocidos, y sus usos es una función básica e importante en una práctica de laboratorio, tan importante como la descripción de nuevos fármacos.

De acuerdo con lo anteriormente expuesto la práctica de farmacología busca orientar al estudiante de medicina en el correcto uso de los medicamentos, basándose en un conocimiento de la farmacocinética, farmacodinamia, interacciones medicamentosas y sus ventajas y desventajas, dosificación de acuerdo a sexo, edad o funciones de órganos blanco, con el fin de que en su práctica clínica cuente con fundamentos teóricos y prácticos que permitan seleccionar los medicamentos que guarden la mejor relación riesgo beneficio prevaleciendo al mismo tiempo criterios de necesidad y efectividad del tratamiento. Adicionalmente busca hacerlos participantes activos de la generación de nueva información basada en la etapa de farmacovigilancia, ayudando a prevenir ocurrencia de eventos adversos, y aumentando la seguridad del paciente.



## **NORMAS GENERALES DE BIOSEGURIDAD EN EL LABORATORIO**

1. Todo estudiante debe entrar al laboratorio con bata limpia y planchada, con su guía de laboratorio y cuaderno de anotaciones.
2. Está prohibido salir del laboratorio durante la práctica.
3. Está prohibido fumar o ingerir alimentos durante la experiencia.
4. Antes de iniciar cualquier experiencia hay que tener un protocolo o guía de lo que se va a realizar, que incluye los objetivos, los materiales y métodos a seguir. No improvise en la medida de lo posible
5. En los trabajos de laboratorio es indispensable cumplir por lo menos con el primer paso del trabajo en ciencias biológicas, como es la observación. Por lo tanto este atento a los fenómenos que ocurran durante el desarrollo de los mismos y anótelos.
6. Estudiantes que por causa justificada deje de asistir a una práctica deberá someterse a una evaluación individual, para lo cual debe procederse según las normas que para los casos de eventos supletorios o diferidos existen.
7. Todo estudiante debe haber asistido al 80 % de las prácticas de laboratorio, para poder tener derecho a la evaluación final.



## PLAN DE TRABAJO DEL ESTUDIANTE

1. Previamente a la práctica, deben conocerse todos los procedimientos que se van a realizar y tener claros los aspectos teóricos correspondientes.
2. El día de su práctica verifique los materiales necesarios para la ejecución de la misma e identifique el funcionamiento de los equipos y simuladores.
3. Practique varias veces el procedimiento y en caso de dudas preguntar a su docente.
4. Al terminar el espacio, elementos, equipos, simuladores o modelos utilizados deben quedar limpios y ordenados.
5. Descarte los materiales usados en los sitios destinados para esto. No deje material contaminado en las mesas de trabajo al finalizar la práctica.
6. Siempre utilice todas las normas de bioseguridad.
7. Después de su práctica anote y/o dibuje acerca del procedimiento realizado y los resultados obtenidos para posteriormente realizar una retroalimentación de lo aprendido en el laboratorio, el examen de la práctica, no solo se limitará a la información proporcionada por el manual o el docente, sino también de sus propias observaciones, investigación y deducciones.



## PRÁCTICA Nº 1: BÚSQUEDA BIBLIOGRÁFICA

### I. INTRODUCCIÓN

En la era de la tecnología, en la que el acceso a la información no es un problema, es una necesidad conocer las herramientas que permitan obtener datos confiables; adicionalmente, el mantenerse al tanto de los avances de las disciplinas practicadas es fundamental para la investigación y optimización del desempeño profesional. Por tal motivo es sumamente necesario conocer las principales fuentes de información y los métodos que permitan realizar búsquedas bibliográficas que brinden datos, procedimientos y/o técnicas confiables.

### II. OBJETIVOS

- Conocer las bases de datos y fuentes de información de medicamentos utilizadas en la práctica médica y ciencias de la salud.
- Reconocer las distintas fuentes de información de medicamentos y lo que aporta cada una a la práctica médica y ciencias de la salud.
- Aprender estrategias de búsqueda de información en las distintas bases de datos y fuentes de información de medicamentos disponibles para la práctica médica y ciencias de la salud

### III. FUNDAMENTO TEÓRICO

Se entiende por fuentes de información de medicamentos el conjunto de instrucciones y técnicas que permiten transmitir conocimientos en materia de medicamentos para optimizar la terapéutica del paciente. Estas pueden clasificarse en primarias, secundarias y terciarias

En 1980 Domingo Bounocore definió como fuentes primarias de información las “que contienen información original no abreviada ni traducida: tesis, libros, artículos



de revista, manuscritos. Se les llama también fuentes de información de primera mano”, pudiendo ser también documentos originales, entrevistas, discursos, cartas, entre otras. En conclusión, las fuentes primarias refieren al lector un testimonio o evidencia proveniente de personas que tienen contacto directo con el fenómeno estudiado, porque lo experimentaron o poseen conocimiento que no fue obtenido a través de otros. Sin embargo, la prensa o artículos de opinión no entran en esta categoría, debido a que la información no mantiene la objetividad necesaria, sino que informan desde un sector en el que expresa ideas desde sus propios intereses.<sup>1</sup>

Las fuentes secundarias de información se caracterizan por haber sintetizado y reorganizado el contenido presente en las fuentes primarias. Su objetivo es facilitar y maximizar el acceso a estas últimas. Se pueden basar en datos pre-elaborados de artículos y documentos relacionados con el tema, bases de datos que tenían otros fines, tesis o informes oficiales, etc.

Las ventajas de usar fuentes secundarias de información son:

- Mayor rapidez y menor costo en la recolección de la información.
- Menor esfuerzo por parte del investigador, debido a que la información ya existe y solo debe adaptarla a su caso específico.

Fuentes terciarias de información: También son conocidas como secundarias refundidas, haciendo referencia a aquellas que son el resultado del tratamiento documental de las fuentes secundarias, remitiendo a otras fuentes o a otros documentos secundarios. Como ejemplo están las bibliografías de bibliografías o guías de obras de referencias, diccionarios, compendios, formularios o las reproducciones de documentos primarios o secundarios como las fotocopias. En la tabla 1 se resumen las fuentes de información terciaria recomendada según la temática buscada.

Entre las desventajas que presentan estas fuentes se encuentra la constante desactualización de la información, ya que el tiempo de publicación entre



ediciones puede ser prolongado y por tanto la información contenida quede obsoleta.

**Tabla 1. Fuentes de información terciarias según cobertura temática**

<b>Monografías de medicamentos</b> <ul style="list-style-type: none"><li>- Martindale the Extra Pharmacopoeia</li><li>- American Hospital Formulary Service Drug</li><li>- Information Drug, Facts and Comparisons</li><li>- USP Drug Information for the health care professional.</li></ul>	<b>Identificación/Disponibilidad</b> <ul style="list-style-type: none"><li>- Catálogo de Especialidades Farmacéuticas del Consejo General de Colegios Oficiales de Farmacéuticos</li><li>- Vademecum Internacional</li><li>- Physicians' Desk Reference</li><li>- Dictionaire Vidal</li><li>- European Drug Index</li></ul>
<b>Toxicología</b> <ul style="list-style-type: none"><li>- E. Barceloux Medical Toxicology.</li><li>- Casaret Toxicology.</li></ul>	<b>Reacciones adversas</b> <ul style="list-style-type: none"><li>- Meyler's. Side Effects of Drugs</li></ul>
<b>Farmacología/terapéutica</b> <ul style="list-style-type: none"><li>- Goodman &amp; Gilman's. The Pharmacological Basis of Therapeutics.</li><li>- Herfintal. Clinical Pharmacy and Therapeutics.</li><li>- Avery's Drug Treatment</li></ul>	<b>Embarazo/Lactancia/teratogenia</b> <ul style="list-style-type: none"><li>- Briggs. Drugs in pregnancy &amp; lactation.</li><li>- Niebyl. Drugs use in pregnancy.</li><li>- Bennet. Drugs and Human Lactation.</li><li>- Meyers. Teratogens.</li></ul>
<b>Estabilidad/compatibilidad de mezclas intravenosas</b> <ul style="list-style-type: none"><li>- Trissel. Handbook on Inyectable Drugs. (ASHP)</li></ul>	<b>Antibioticoterapia</b> <ul style="list-style-type: none"><li>- Mandell. Principles and Practice of Infections Disease.</li><li>- Sandford JP. Guide to antimicrobial therapy Inc.,</li><li>- Bethesda.</li></ul>
<b>Interacciones</b> <ul style="list-style-type: none"><li>- Hansten. Drugs Interactions.</li></ul>	<b>Farmacocinética</b> <ul style="list-style-type: none"><li>- Evans. Applied Pharmacokinetics. Principles of Therapeutic Drug Monitoring</li></ul>

Como fuentes de información alternativas se incluyen Internet, centros de Información regionales o nacionales y la Industria Farmacéutica (la industria



farmacéutica dispone de centros de información sobre los medicamentos que comercializan). La mayoría de los laboratorios tienen extensos archivos de sus productos y aceptan consultas, a las que se puede acceder como complemento a las fuentes anteriores.

Entre las fuentes de información más consultadas por profesionales de la salud se encuentran las secundarias, que en su mayoría están disponibles en medio Online y magnético, destacando Medline, Embase, IPA (International Pharmaceutical Abstract), The COCHRANE Library, Currents Contents. En estas debe tenerse en cuenta el lenguaje al momento de hacer la búsqueda por lo cual se han creado una serie de palabras clave y descriptores, las cuales conforman un vocabulario controlado y dinámico que se utiliza para la indización de un documento y para su posterior recuperación. La misión de estos descriptores es la de homogeneizar el lenguaje científico a nivel mundial facilitando y dinamizando la búsqueda de la información.

Las palabras clave deben estar enlazadas por los denominados operadores booleanos, los cuales permiten establecer relaciones sintácticas entre los términos de la consulta. Las bases de datos reconocen al menos tres operadores principales:

- Operador de intersección: **Y** (and cuando la consulta se hace en inglés).<sup>2</sup>
- Operador de unión: **O** (OR en inglés).
- Operador de exclusión **NO** (NOT en inglés).

#### **IV. MATERIALES Y EQUIPOS**

- Diccionario de especialidades farmacéuticas.
- Vademécum.
- Bases de datos institucionales.
- Bases de datos de libre acceso.

#### **V. PROCEDIMIENTO**



Utilizando las fuentes de información mencionadas haga un listado de 5 fármacos pertenecientes a los siguientes grupos terapéuticos:

- Fármacos analgésicos y antiinflamatorios no esteroideos (AINES).
- Fármacos antihistamínicos.
- Fármacos corticoides.
- Fármacos antibacterianos.

De cada fármaco mencionar

- Nombre genérico.
- Dosis usual en adultos y niños.
- Características farmacocinéticas: tiempo de vida media, volumen de distribución, porcentaje de unión a proteínas plasmáticas y vía de eliminación
- Mecanismo de acción.
- Indicaciones.
- Reacciones adversas.
- Precauciones y contraindicaciones.

## **VI. CUESTIONARIO**

1. ¿Cuál es la diferencia que existe entre fuente de información primaria, secundaria y terciaria?
2. Mencione tres diferencias entre: vademécum, diccionario de especialidades farmacéuticas y martindale.
3. ¿Qué es un formulario farmacoterapéutico y en qué se diferencia del listado POS (Plan obligatorio de salud)?

## **PRÁCTICA N 2 FORMAS FARMACÉUTICAS**

### **I. INTRODUCCIÓN**



Conocer las formas farmacéuticas disponibles en el medio es una necesidad para realizar una prescripción correcta y aumentar la adherencia de los pacientes al tratamiento farmacológico, luego de la identificación y aislamiento del principio activo, la elección de los excipientes y la forma farmacéutica es fundamental, definiéndose esta última como la manera en que finalmente viene presentado el medicamento para ser administrado. Para su elección se tiene en cuenta aspectos como el tipo de paciente al cual se le va a administrar, el tipo de enfermedad que se va a tratar, la localización de la patología, la vía de administración, el sitio de absorción y las características físico-químicas del principio activo.

## **II. OBJETIVOS**

- Distinguir en forma práctica las presentaciones de los medicamentos.
- Diferenciar la información presente en las formas farmacéuticas y su utilidad.
- Reconocer las ventajas y desventajas de las formas farmacéuticas en la terapéutica.

## **III. FUNDAMENTO TEÓRICO**

Se entiende por formas farmacéuticas como la forma física en la que finalmente es presentado el medicamento en el mercado, con el fin de facilitar la administración y dosificación del principio activo (fármaco) y su liberación en el momento y sitio adecuados para que se logre una correcta acción; entre alguna de las funciones de las formas farmacéuticas se encuentran el proteger al fármaco de factores externos como luz o humedad, facilitar su administración, enmascarar sabores u olores desagradables y brindarle estabilidad química.<sup>4</sup>

Las formas farmacéuticas se pueden clasificar en:

- Sólidas: Los más comunes las tabletas y grageas (comprimidos) aunque también se encuentran frecuentemente en polvos y granulados.



- Semisólidas: Se caracterizan por no ser 100% sólidas ni 100% líquidas, su consistencia es intermedia, entre ellas se encuentran las cremas, pomadas, geles, ungüentos y supositorios
- Líquidas: Las soluciones, elixir o jarabes por tener una sola fase se encuentran entre las homogéneas, las emulsiones, suspensiones, aerosoles formarán el grupo de las heterogéneas por presentar dos o más fases
- Gaseosas: Estos fármacos pueden ser elementos puros como nitrógeno u oxígeno, mezclas de varios o ser de origen semisintético o sintético como es el caso de los anestésicos

### **Formas sólidas**

- Polvos: Son la forma más simple de formas sólidas. consisten en la mezcla de uno o más principios activos y excipientes de manera homogénea. Se pueden administrar directamente o ser mezclados con agua para formar una solución o una suspensión. Deben ser disueltos o suspendidos en un medio adecuado inmediatamente antes de ser utilizados con el fin de evitar deterioro del fármaco durante su almacenamiento; su forma de presentación es en frascos viales o en ampollas.
- Granulados: Son formas farmacéuticas en la que partículas de polvo son humectadas se y pasadas por tamices para posteriormente ser secados, estos son mezclados con agua u otros líquidos para disolverlos o suspenderlos.
- Tabletas o Comprimidos: Mezcla homogénea de polvos sometidos a presión por un punzón dentro de una matriz (tableteadora); pueden presentar diversas formas y tamaños, algunas tienen ranuras que indican el lugar por el que se pueden fraccionar. Si el comprimido no es ranurado no hay garantía que cada mitad tenga la misma cantidad de principio activo, adicionalmente se puede incurrir en el error de dividir en una tableta de liberación modificada lo que podría causar sobredosificación.



- **Pastillas:** Básicamente son similares a las tabletas salvo que de mayor tamaño, por lo general no se pueden deglutir y han sido diseñadas para dejar disolver lentamente en la cavidad oral, buscando efectos locales.
- **Grageas:** Es comprimido con una capa o recubrimiento azucarado, el recubrimiento tiene la función de proteger al principio activo de la luz, humedad y enmascarar algún sabor u olor desagradable. Las grageas convencionales no son resistentes a la acción del ácido clorhídrico y por tanto su desintegración y disolución se inicia en el propio estómago.
- **Grageas de cubierta entérica:** Son grageas con recubrimiento externo, el cual lo hace resistente al pH gástrico, presentándose la desintegración de la forma farmacéutica y liberación del principio activo solo al llegar a la porción del intestino delgado que presente un pH neutro o alcalino. adicionalmente protegen al estómago de la acción irritante de algunos componentes de la forma farmacéutica.
- **Cápsulas:** Son formas farmacéuticas hechas de gelatina que pueden contener sólidos o líquidos, se pueden administrar por vía oral y vaginal; en el tubo digestivo la cápsula se disuelve, liberando su contenido. Según sea su consistencia, existen cápsulas de gelatina dura formadas por dos partes: el cuerpo y la cabeza, y cápsulas de gelatina blanda que siempre son selladas. Utilizando ésta forma farmacéutica, se evita el sabor u olor desagradable de algunos medicamentos. <sup>5</sup>

**Formas semisólidas:** Son formas farmacéuticas que permiten la aplicación tópica en piel o mucosas.

- **Geles:** Son preparados lavables transparentes y generalmente incoloros.



- Cremas: Son suspensiones de aceite en agua y poseen acción secante, muy útiles en procesos húmedos.
- Pomadas o Ungüentos: Son formas farmacéuticas libres de agua para uso externo, de consistencia blanda y que tienen el principio activo junto con una base oleosa que otorga masa y consistencia.
- Pastas Son pomadas cuya base está conformada principalmente de polvos insolubles como talco u óxido de cinc.

### **Formas líquidas**

- Soluciones: Son mezclas homogéneas resultantes de la disolución de un fármaco sólido o líquido en un solvente, pueden ser de uso interno o externo.
- Gotas: Son soluciones tópicas estériles que se utilizan en la mucosa nasal (gotas nasales), oftálmica (colirios), o en el conducto auditivo externo (gotas óticas).
- Inyectables Son formas de dosificación estériles, libres de pirógenos y en lo posible isotónicas que han sido diseñadas para administración parenteral; pueden ser soluciones, suspensiones o emulsiones en medios acuosos o no acuosos y que son usualmente clasificadas de acuerdo con su vía de administración.
- Jarabes: Son soluciones que además contienen una buena proporción de azúcar con el fin de mejorar el sabor de los fármacos; usualmente se les adiciona además agentes saborizantes, por lo cual es necesario tener mucha precaución con los niños, quienes pueden presentar cuadros de intoxicaciones agudas por la ingestión de todo el contenido del frasco.

También se debe tener en cuenta la presencia del azúcar para no prescribir ésta forma a los pacientes diabéticos.



- Elíxires: Son soluciones hidroalcohólicas con o sin azúcar de fármacos poco solubles en agua y a las que se adiciona el alcohol tratando de mejorar su solubilidad.
- Emulsiones: Son formas farmacéuticas de aspecto cremoso constituidas por pequeñas gotas de una fase oleosa unidas a una fase acuosa o viceversa, dicha unión es mediada por un agente emulsificante o tensoactivo. El fármaco puede estar en cualquiera de las fases o suspendido en la emulsión, las suspensiones generalmente son para administración por vía oral y su uso por vía parenteral se limita a casos especiales.
- Colirios: Son soluciones isotónicas y estériles de uso oftálmico; la mayoría es de uso local.
- Aerosoles: Son soluciones envasadas bajo presión, cuya aspersion permite la salida de gotas que varían su tamaño desde 1-100  $\mu\text{m}$  y que pueden utilizarse en piel, mucosa nasal o de la cavidad orofaríngea. Su acción puede ser local o sistémica

De igual manera, las formas farmacéuticas también pueden clasificarse de acuerdo a la forma de liberación del principio activo en:

**Formas farmacéuticas de liberación convencional:** Son formas farmacéuticas en las que la liberación del principio activo no está modificada por un diseño farmacotécnico especial. En el caso de los sólidos, el perfil de disolución depende principalmente de las propiedades intrínsecas del producto.

**Formas farmacéuticas de liberación modificada:** Formas farmacéuticas en las que la velocidad y el lugar de liberación del principio estarán condicionadas por un método de fabricación especial, las cuales harán que el contenido se libere en el tiempo de manera prolongada, retardada, sostenida o en forma de pulsos.



**Formas farmacéuticas de liberación prolongada:** Son preparaciones en las que el principio activo se libera con mayor lentitud que la de una forma farmacéutica de liberación convencional administrada por la misma vía. Su finalidad es preservar concentraciones fijas del principio activo en un tiempo prolongado.

**Formas farmacéuticas de liberación retardada:** Son formas farmacéuticas cuyo diseño permite que la liberación del principio activo sea retardado en el tiempo en comparación a una de liberación convencional.

**Formas farmacéuticas de liberación pulsátil:** Son preparaciones en las que el principio activo se libera en forma de pulsos, este diseño garantiza la liberación secuencial del principio activo.<sup>6</sup>

#### **IV. MATERIAL**

- Diferentes presentaciones de medicamentos
- Fuentes de información institucionales

#### **V. PROCEDIMIENTO**

Seleccionar 4 formas farmacéuticas sólidas, 4 semisólidas, 4 líquidas y describir de cada una:

- Nombre genérico y nombre comercial
- Registro sanitario
- Concentración
- Vía de administración
- Características de conservación del producto



## VI. CUESTIONARIO

1. Seleccione un medicamento de cada forma farmacéutica y describa el principio activo y los excipientes.
2. Escriba la diferencia entre pastilla, tableta, gragea y cápsula.
3. ¿Cuál es el objetivo del recubrimiento entérico en un preparado farmacéutico?
4. ¿A que se denomina preparación extemporánea?, de tres ejemplos.



## PRÁCTICA N° 3 DISOLUCIÓN Y DESINTEGRACIÓN DE FORMAS FARMACÉUTICAS SÓLIDAS ORALES

### I. INTRODUCCIÓN

La Farmacocinética explica la permanencia del fármaco en el organismo, cuantificando todos los procesos que se producen permitiendo medir la concentración de los fármacos en diferentes órganos, el conjunto de procesos farmacocinéticos que se dan cuando se administra un medicamento se conoce bajo el acrónimo LADME (Liberación, absorción, distribución, metabolismo y excreción). La liberación constituye la “salida” del fármaco de la forma farmacéutica que lo transporta, por lo general implica la disolución del fármaco en algún medio corporal, este proceso influye directamente en la cantidad de fármaco que será absorbido, y depende del diseño farmacéutico, medio en el que se encuentre y condiciones fisiológicas del paciente; por lo cual es importante que se comprenda su importancia para lograr el objetivo terapéutico.

### II. OBJETIVOS

- Comprender la importancia que tiene el pH del medio en el proceso de liberación del fármaco de su forma farmacéutica.
- Comprender la relación existente entre disolución de la forma farmacéutica y concentración plasmática del fármaco.

### III. FUNDAMENTO TEÓRICO

La absorción de los fármacos desde una forma farmacéutica sólida depende principalmente de la liberación del principio activo y disolución en los medios fisiológicos. Estos pasos constituyen el principio para correlacionar que la disolución *in vitro* predice el rendimiento *in vivo* de la forma farmacéutica, por esta razón las pruebas de disolución *in vitro* son utilizadas en comprimidos y cápsulas. <sup>5</sup>



La naturaleza del medio de disolución debe ser considerada de manera que este disuelva bien al medicamento, las farmacopeas oficiales tienen definidos todos estos aspectos, incluyendo la concentración de las soluciones para cada preparado farmacéutico, principalmente los de administración oral. Esto fue establecido de acuerdo a las propiedades de los productos farmacéuticos como pH, pKa, y el lugar donde se da una mejor de absorción (intestino o estomago) buscando replicar las condiciones fisiológicas de estos órganos.<sup>6</sup>

#### **IV. MATERIALES**

Vasos de precipitado	Gragea de Sulfato ferroso
Solución salina	Tableta de Ácido acetil salicílico
Ácido clorhídrico	Tableta de Acetaminofén
Hidróxido de sodio	Cápsula de Omeprazol
Agua destilada	Tabletas de ácido acetil salicílico con cubierta entérica

#### **V. PROCEDIMIENTO EXPERIMENTAL**

1. Tomar cuatro (4) vasos de precipitado y colocar en cada uno de ellos 20 mL de cada una de las soluciones antes mencionadas. Agregar a cada uno un medicamento y determinar el tiempo de desintegración y el tiempo de disolución utilizando un cronometro.
2. Determinar el pH de la solución final.



## VI. CUESTIONARIO

Con la información obtenida de la práctica de laboratorio desarrolle la siguiente tabla.

Forma Farmacéutica	Tiempo de desintegración			
	SSN 0.9%	HCL	NaOH	H <sub>2</sub> O
Tabletas				
Tabletas efervescente				
Capsulas				
Gragea				
Gragea con cubierta entérica				



## PRÁCTICA N° 4 CÁLCULO DE DOSIS

### I. INTRODUCCIÓN

En la práctica clínica es común realizar cálculos relacionados con las necesidades de medicamentos que tienen los pacientes, con el fin de prescribir las dosis adecuadas pero sobre todo de garantizar la seguridad de la farmacoterapia, por lo que es fundamental que el cuerpo médico maneje las operaciones que permitan obtener las diluciones y tiempos de administración más recomendados. Para realizar estos cálculos se debe estar diestro en el manejo básico de operaciones matemáticas, por lo que se hace necesario sentar los fundamentos de lo encontrado comúnmente en una institución de salud y de esa manera garantizar la seguridad de los paciente.

### II. OBJETIVOS

- a) Comprender las metodologías existentes para calcular las dosis de pacientes adultos, pediátricos y neonatos.
- b) Identificar los casos en los que deben ser utilizadas las fórmulas para calcular las dosis de pacientes pediátricos y neonatos.
- c) Calcular dosis de pacientes adultos, pediátricos y neonatos.

### III. FUNDAMENTOS TEÓRICOS

El efecto de un medicamento depende en gran parte de la cantidad de fármaco presente en la biofase, y esta a su vez depende de factores como la dosis, biodisponibilidad del fármaco, velocidad de biotransformación o velocidad de eliminación.



Usualmente la dosis se calcula con base en el peso del paciente, sin embargo, en niños debe tenerse en cuenta variables como la edad o superficie corporal, aunque en situaciones particulares, como sucede con la insulina, la dosis no depende del peso del individuo sino de la gravedad de la enfermedad.

Para calcular la dosis en niños existen varias reglas:

**Clark:**

$$\text{Dosis} = \frac{\text{Peso del niño (Kg)} \times \text{D. A.}}{70} \quad \text{Para niños mayores de 2 años}$$

**Fried:**

$$\text{Dosis} = \frac{\text{Edad (en meses)} \times \text{D.A.}}{150} \quad \text{Para niños menores de (0-2) años}$$

**Young:**

$$\text{Dosis} = \frac{\text{Edad (años)} \times \text{D.A.}}{\text{Edad (años)} + 12} \quad \text{Para niños de 1-12 años.}$$

D.A. = Dosis usual del adulto.

**El método del área de superficie corporal:**

$$\frac{\text{Superficie corporal del niño (m}^2\text{)} \times \text{D.A.}}{1.73 \text{ m}^2}$$

La superficie corporal se puede hallar mediante el monograma de Dubois o por la fórmula:

$$\text{Superficie corporal (m}^2\text{)} = \frac{\text{Peso (Kg)} \times 4.7}{\text{Peso (Kg)} + 90}$$



**Ejercicio 1:** La dosis de Difenhidramina es de 5mg/Kg. ¿Cuál será el volumen a administrar a un paciente de 50 Kg .de peso, si la solución está al 5%?

5mg-----1Kg.

X-----50Kg.

$$X = \frac{50 \text{ Kg} \times 5 \text{ mg.}}{1 \text{ Kg}} = 250 \text{ mg}$$

Una solución al 5 % contiene 5mg. En 100mL.

5.000mg-----100mL.

250mg----- X

X = 5mL.

**Calculo de velocidad de infusión:**

Recuerde que:

1mL= 60 microgotas

1mL= 20 normogotas

1mL= 10 Macrogotas

**Ejercicio 2:** Paciente masculino de 43 años de edad y 70 Kg de peso con diagnóstico de insuficiencia cardiaca congestiva descompensada, al que se le prescribe dopamina a dosis de 5µg/kg/min, la cual será administrada por bomba de infusión. Calcule la velocidad de infusión, si en la institución se cuenta con ampollas de dopamina de 200mg/5mL y bolsas de 250mL de DAD5%

**R/** Como la administración se realizará con la ayuda de bomba de infusión (las unidades en que se debe expresar la velocidad de infusión será mL/h), el primer paso es calcular cuántos µg debe recibir el paciente por hora:



$$\frac{5\mu\text{g} \times 70 \text{ kg} \times 60 \text{ min}}{\text{min}} = 21000 \mu\text{g/h}$$

Por otra parte se preparará la solución conformada por la ampolla de dopamina y la bolsa de DAD 5%, la cual resultará con una concentración de 200 mg en 255 mL, o 200000  $\mu\text{g}$  en 255 mL (los 255 mL son resultantes de la sumatoria de los volúmenes de la ampolla y la DAD5%)

Posteriormente se calculan cuantos mL/h de solución necesita el paciente de acuerdo a la dosis (21000  $\mu\text{g}$ ):

$$\begin{array}{l} 200000 \mu\text{g} \text{-----} 255\text{mL} \\ 21000 \mu\text{g} \text{-----} x \\ x = 26,7\text{mL.} \end{array}$$

R./ la mezcla debe pasarse a 26,7mL/h.

#### IV. MATERIALES

- Calculadora
- Lápiz y borrador
- Hojas cuadriculadas

#### V. DESARROLLO

1. Para el paciente del ejercicio 2 visto anteriormente, calcular la velocidad de infusión en microgotas/min.



2. Si la dosis de Difenhidramina en adultos es 50 mg, ¿Qué dosis se debe prescribir a un niño de 5 años?
3. Preparar 500 mL de solución hipertónica (3%) a partir de ampollas de NaCl (concentración es 11.7% y volumen de 10mL) y bolsas de agua destilada cuyo volumen es 500mL.
4. En la institución en que trabaja se cuenta con ampollas de oxitocina de 10 U.I./mL para inducir la contractilidad uterina; a una paciente se decide administrar 20 mU.I./min ¿Cuántas normogotas por minutos hay que pasar si se disuelve la ampolla en 500mL de DAD5%?

## VI. CUESTIONARIO

1. Mencione tres factores fisiológicos que puedan modificar la dosis de un medicamento.
2. ¿Qué isoenzimas del CYP450 se encuentran presentes en neonatos y no en adultos?
3. Mencione cinco medicamentos en los que se debe controlar las dosis mediante su monitorización de los niveles plasmáticos.
4. ¿A qué se debe que la mayoría de las dosis en adultos no sean prescritas en mg/Kg?
5. ¿Qué es dosis diaria definida?



## PRÁCTICA N° 5 VÍAS DE ADMINISTRACIÓN

### I. INTRODUCCIÓN

El diseño farmacéutico en el que se presentará de manera definitiva el medicamento en una forma farmacéutica y la escogencia de la vía de administración por la que finalmente ingresara al organismo son características fundamentales para el éxito de la terapia, tanto como la misma molécula activa; según el tratamiento, edad y estado del paciente, se debe utilizar una determinada vía de administración, por lo tanto la elección debe realizarse con rigor y adecuarse a las necesidades del caso, por lo que es trascendental conocer las ventajas y desventajas que brinda cada una de las vías de administración, así como también las técnicas correctas para garantizar el éxito de la terapia.

### II. OBJETIVOS

- Reconocer las distintas vías para administración de medicamentos.
- Conocer las ventajas y desventajas que brinda cada una de las vías de administración de medicamentos.
- Realizar la administración de medicamentos utilizando las principales vías de administración.

### III. FUNDAMENTO TEÓRICO

La administración oral de los medicamentos es la forma más utilizada por ser segura, económica; entre sus desventajas se encuentran la disminución de la absorción de algunos fármacos por sus características físicas, irritación de la mucosa gastrointestinal, destrucción por enzimas digestivas o el pH gástrico bajo, interacciones con alimentos u otros fármacos. Por otro lado, la administración parenteral tiene grandes ventajas sobre la oral, por ejemplo, permite suministrar la



forma activa del fármaco, lograr una mayor biodisponibilidad, tratar rápidamente las emergencias o utilizarse en pacientes inconscientes; entre las desventajas se encuentran: estar entrenado en una técnica aséptica, puede ser dolorosa, son pocos los casos en que el mismo paciente puede administrarse los medicamentos.

- Vía de administración oral: La absorción en el tubo digestivo depende de factores fisiológicos y de características del fármaco como el área de superficie del tracto gastrointestinal con que estará en contacto el fármaco administrado, la corriente sanguínea en el sitio de absorción, la forma farmacéutica, hidrosolubilidad y concentración. La absorción de las formas farmacéuticas sólidas depende de la cantidad y velocidad con que se disuelven, y se ve favorecida cuando se encuentra en la forma no ionizada por ser más lipofílica. Se puede asegurar que los fármacos que son ácidos débiles se absorberían mejor en un pH 1-2, que es el que se encuentra en el estómago, sin embargo, el epitelio gástrico está recubierto con una gruesa capa de moco y su superficie es pequeña; en cambio, las vellosidades de la parte proximal del intestino conforman una superficie enorme. Por esa razón, la fracción absorbida de un fármaco será mayor en el intestino que en el estómago, aunque se encuentre predominantemente ionizado en el intestino y altamente no ionizado en el estómago. <sup>3</sup>
- Vía sublingual: Los medicamentos administrados por esta vía no son deglutidos sino que son disueltos y absorbidos en la misma boca, como su nombre lo indica el medicamento es colocado debajo de la lengua, transportándose a través de los vasos sanguíneos sublinguales hasta la vena cava superior, logrando evitar el efecto de primer paso hepático. Esta vía es utilizada cuando se necesita una acción inmediata del medicamento, como ejemplo se encuentran los comprimidos de isosorbide indicados para la angina de pecho.



- Vía tópica: Se utiliza este término para aquellos medicamentos que se administran sobre la piel, funcionando esta última como una barrera que impide el paso hasta la sangre, por esta razón se pueden administrar mayores concentraciones que las utilizadas por otras vías, sin embargo se debe tener especial cuidado cuando la piel está dañada, por ejemplo en quemaduras, debido a que aumenta el riesgo de paso al torrente sanguíneo pudiendo provocar efectos indeseables. Los medicamentos administrados son corticoides, antibióticos y antisépticos.<sup>4</sup>
- Vía transdérmica: A diferencia de los fármacos administrados por la vía tópica, la vía transdérmica permite el paso de los productos administrados a la circulación provocando acción a nivel general; la aparición de los sistemas terapéuticos transdérmicos o sistemas percutáneos han permitido una liberación controlada y constante durante un periodo mayor de tiempo que el conseguido con las formas farmacéuticas tradicionales lo cual facilita la adherencia terapéutica.
- Vía rectal: En esta vía se introduce el medicamento en el recto a través del ano, generalmente el 50% del fármaco que se absorbe por el recto evita el paso por el hígado, reduciendo así el efecto de primer paso, sin embargo esto dependerá si el producto está en contacto con la venas hemorroidales superiores (las cuales irán a la vena porta por medio de la mesentérica inferior y a su vez al hígado) o con las inferiores (transportaran el fármaco a circulación general). Hay que escoger bien los productos que se administraran por esta vía para no producir irritación, adicionalmente se debe tener en cuenta que la heces evitan una absorción completa del fármaco.<sup>5</sup>



- Vías parenterales: Pueden dividirse en parenterales con efecto sistémico o con efecto local. Entre las primeras se encuentran la intravenosa, intraarterial, intramuscular, subcutánea, inhalatoria, intraarticular o intraperitoneal; las segundas están compuestas de la intratecal, intraventricular, intracardiaca, vaginal, ótica y tópica. Las principales vías de administración parenteral son la intravenosa, subcutánea e intramuscular, la absorción desde las vías subcutáneas e intramusculares se da por difusión simple. La velocidad depende del área de las membranas capilares absorbentes y la solubilidad del fármaco en el líquido intersticial.

La administración intravenosa brinda muchas ventajas pero también desventajas. Cuando se obtienen concentraciones altas de un fármaco o su vehículo en el plasma y los tejidos pueden ocurrir reacciones desfavorables, a pesar de esto existen situaciones en las que la relación riesgo/beneficio dictamina la necesidad de administrar bolos de fármaco aunque en otras es más aconsejable inyectar un fármaco con lentitud. La utilización de esta vía, requiere vigilancia cercana de la respuesta del paciente, debido a que una vez administrado el medicamento se hace difícil dar marcha atrás.

- Vía subcutánea: Una de las características que deben tener los fármacos utilizados por esta vía es que no sean irritantes, debido a que favorecen la aparición de dolor, necrosis y esfacelo hístico. La administración subcutánea permite que la absorción del fármaco sea constante y lento, lo que permite que el efecto sea prolongado, entre las estrategias utilizadas para retrasar la absorción de fármacos por esta vía se encuentra la de agregar un vasoconstrictor al preparado.
- Intramuscular: La velocidad de absorción de los fármacos por esta vía dependerá principalmente de dos factores, el primero de ellos es la naturaleza oleosa o acuosa del medicamento, si se trata de una solución acuosa



aumentara la velocidad de absorción después de su inyección intramuscular; el segundo será el flujo sanguíneo, al que la absorción será directamente proporcional. Este último puede regularse con calor, masaje local o ejercicio. Hay que tener en cuenta que la velocidad de absorción de un fármaco en solución acuosa es más rápida si se inyecta en el deltoides o que en el glúteo mayor, aunque en este último músculo la velocidad de absorción es menor en el sexo femenino, debido a que la distribución de grasa subcutánea en hombres y mujeres es diferentes, y que la grasa tiene una perfusión relativamente pobre. Si el fármaco es administrado en solución oleosa u otros vehículos con efecto reservorio, la absorción será más lenta y constante.

- Intra arterial: La utilización de esta vía requiere entrenamiento y por ser de gran cuidado debe ser utilizada solamente por expertos, entre sus principales ventajas se encuentra la evitar el metabolismo de primer paso y los efectos depuradores pulmonares. Se utiliza cuando se necesita un efecto localizado en un tejido u órgano particular.
- Vía Intratecal: Cuando se desea obtener efectos locales y rápidos en las meninges o el eje cefalorraquídeo, los fármacos pueden ser administrados directamente en el espacio raquídeo subaracnoideo. La barrera hematoencefálica y la que separa la sangre y el líquido cefalorraquídeo impiden o retrasan la penetración de fármacos al sistema nervioso central.
- Vía inhalatoria. Por esta vía son administrados los fármacos gaseosos y líquidos volátiles, los cuales se absorberán a través del epitelio pulmonar y las mucosas de las vías respiratorias; entre sus ventajas está:<sup>6</sup>
  - Rápido acceso a la circulación
  - Absorción casi instantánea de fármacos
  - Evita el efecto de primer paso hepático



#### **IV. MATERIALES**

- 2 Jeringas desechables 5 mL
- 1 Jeringa desechable de 1mL
- 2 Catéteres endovenosos N° 20G
- 2 Agujas hipodérmicas 21 x 1 ½
- Alcohol 70°
- Algodón
- Solución salina 0.9%
- Guantes de látex

#### **V. DESARROLLO**

##### **Vía de administración IM**

##### **PROCEDIMIENTO.**

1. Antes de la administración del medicamento hay que desinfectar la piel con algodón impregnado de alcohol antiséptico realizando un movimiento circular desde adentro hacia afuera abarcando un diámetro de aproximadamente 5 cm en el lugar seleccionado (Tabla 1).
2. La aguja se debe introducir formando un ángulo de 90° con un movimiento firme y seguro, en un solo acto. Antes de introducir el medicamento siempre se debe jalar el embolo para estar seguros que no se está ubicado en un vaso. En caso de extraer sangre se debe retirar la aguja y pinchar en otro lugar.
3. El medicamento debe administrarse lentamente, se esperaran unos diez segundos antes de retirar la aguja, de esta manera se evitara cualquier pérdida de medicamento.



**Tabla 1. Áreas para aplicar inyección intramuscular**

AREA	POSICION DEL PACIENTE	VOLUMEN ADMITIDO	PRECAUCIÓN	OTROS
Dorsoglútea	Decúbito lateral Decúbito prono Bipedestación	Hasta 7 mL	Nervio ciático	Evitarla en menores de 3 años De elección en mayores de 3 años
Deltoidea	Todas	Hasta 2 mL	Nervio radial	
Ventroglútea	Decúbito lateral Decúbito supino	Hasta 5 mL		De elección en mayores de 3 años
Cara externa del muslo	Decúbito supino Sedestación	Hasta 5 mL		De elección en menores de 3 años

#### **Vía de administración IV**

1. Inmovilizar la vena con la mano a unos 5 cm por debajo del lugar de punción.
2. Realizar la venopunción, la cual puede hacerse de dos maneras:
  - El directo: la punción es directo sobre la vena
  - El indirecto: la punción se realiza en una zona cercana al vaso y posteriormente se dirige la aguja hacia él.

Siempre se debe Insertar la aguja con el bisel hacia arriba en un ángulo de 30-40 grados respecto a la piel. Se prueba si retorna sangre hacia la cámara trasera del catéter lo que indicaría que la aguja ha entrado a la vena. Posteriormente se ubica la aguja con el fin que quede lo más paralelamente posible a la superficie cutánea, y que la mano no dominante introduzca el catéter mientras que la otra retira el fijador.

#### **Vía de administración SC**



Los fármacos pueden ser administrados en el tercio medio de la cara externa del muslo o del brazo, en la cara anterior del abdomen, en la zona escapular o en la cresta iliaca

Los pasos a seguir a la hora de administrar un medicamento subcutáneo son:

1. Desinfectar la piel con algodón y alcohol antiséptico realizando un movimiento de espiral hacia afuera en un diámetro aproximado de 5 cm.
2. Tomar un pliegue de la piel del paciente de unos 2 cm.
3. Con el bisel hacia arriba, colocar la aguja formando un ángulo de 45 grados respecto a la base del pliegue que se ha formado.
4. Insertar la aguja unos 3-4 mm, posteriormente aspirar para verificar que no se ha perforado un vaso. De ser así se debe retirar la aguja y repetir el procedimiento en otro lugar.
5. Soltar el pliegue e introducir lentamente el medicamento, retirar la aguja. (No se debe masajear la zona.)

## **VI. CUESTIONARIO**

1. ¿Con qué fase de la farmacocinética se relaciona la vía de administración?
2. Mencione 4 ventajas de la administración intravenosa.
3. Haga un listado de las ventajas y desventajas que ofrece las vías oral, sublingual y rectal.
4. Señale en qué casos deben utilizarse las vías intradérmicas subcutáneas, intramuscular y endovenosa.
5. ¿Qué precauciones debe tenerse al utilizar la vía intravenosa?
6. Describa brevemente en qué consisten las vías de administración intratecal, intraarterial e intraperitoneal.



## PRÁCTICA N° 6 FARMACODINAMIA

### I. INTRODUCCIÓN

La farmacodinamia es la rama de la farmacología encargada del estudio de los efectos bioquímicos y fisiológicos de los fármacos y su mecanismo de acción, debido a que el profundo análisis de las acciones farmacológicas establecen las bases para el empleo racional de los fármacos. Asimismo, la investigación básica en farmacodinamia ofrece conocimientos fundamentales sobre la regulación bioquímica y fisiológica, esta práctica permitirá a los estudiantes conocer los fundamentos de la farmacodinamia y su importancia en la clínica.

### II. OBJETIVOS

- Comprender el mecanismo de acción de los fármacos estructuralmente específicos y no específicos.
- Conocer los distintos tipos de receptores farmacológicos y su importancia en la terapéutica.
- Reconocer las distintas interacciones que pueden existir entre fármacos y receptores.

### III. FUNDAMENTO TEÓRICO

El término receptor se utiliza para referirse a estructuras generalmente de origen proteico a la cual se une un mediador endógeno y desencadenamiento de una señal reguladora de la célula diana. Aprovechando su existencia, la estructura de los fármacos es diseñada para que exista afinidad y se pueda dar una unión. Los fármacos que se ligan a receptores y mimetizan los efectos de los compuestos endógenos reciben el nombre de agonistas, mientras que otros se unen sin generar efecto pero bloquean la unión de la sustancia endógena o del fármaco



agonista, estos reciben el nombre de antagonistas. Otros fármacos que se unen a los receptores son parcialmente eficaces como agonistas, estos son denominados agonistas parciales, y los que se unen al receptor en su forma inactiva para inactivarlos más, se denominan agonistas inversos.<sup>7</sup> La unión de los fármacos con los receptores se da mediante enlaces químicos, cuando son débiles priman los puentes de hidrogeno, enlace iónico, hidrofóbico, fuerzas van der Waals y cuando son fuertes se da mediante enlaces covalentes, en estas interacciones la acción del fármaco suele ser prolongada o irreversible, aunque las interacciones no covalentes de gran afinidad también pueden serlo.<sup>8</sup>

#### **IV. MATERIALES**

- Textos de farmacología
- Bases de datos disponibles

#### **V. PROCEDIMIENTO**

Para cada uno de los problemas planteados se deberán considerar las siguientes Consignas:

1. ¿El fármaco administrado al paciente es agonista o antagonista? ¿Cuál es su mecanismo de acción?
2. Defina el concepto de receptor farmacológico. Tipos y subtipos
3. Si el fármaco del problema planteado no actúa mediante un receptor, indique su mecanismo de acción, detallando los efectos celulares que produce.

#### **Caso 1:**

Paciente femenina de 37 años de edad que presenta con dolor posterior a trauma, a la cual se prescribe el Naproxeno, comprimidos recubiertos, a una dosis de 440mg/día, por vía oral. Como adicionalmente padece de asma bronquial se medica con Salbutamol, Ipratropio y Beclometasona.



**Caso 2:**

Paciente femenina de 21 años de edad, con infección de vías urinarias a quien se le prescribe dicloxacilina 100 mg/12 horas VO y que al momento de la consulta presenta anorexia, náuseas, vómitos y cefaleas,

**Caso 3:** Paciente masculino de 49 años con historia familiar de hipertensión arterial, medicado con metoprolol y enalapril.

**VI. DESARROLLO**

1. Defina el concepto de receptor farmacológico. Cite ejemplos.
2. Identifique los posibles mecanismos de interacción entre el fármaco y su receptor.
3. Establezca el concepto de fármaco agonista, antagonista, agonista parcial y agonista inverso.
4. ¿Qué es taquifilaxia?



## **PRÁCTICA N° 7 FARMACOS DEL SISTEMA NERVIOSO AUTÓNOMO**

### **I. INTRODUCCIÓN**

El sistema nervioso autónomo, también denominado visceral, vegetativo o involuntario está distribuido ampliamente en el cuerpo y es el encargado de regular funciones autónomas que se producen sin control consciente. En la periferia incluye nervios, ganglios y plexos que llegan al corazón, vasos sanguíneos, glándulas, otras vísceras y músculo de fibra lisa en diversos tejidos. Entre sus funciones está regular la presión arterial, motilidad y gastrointestinal secreciones digestivas, control de salida o retención urinaria, sudoración y temperatura corporal. Por lo cual es fundamental que los estudiantes de medicina comprendan su funcionamiento y la de los fármacos que lo modulan.

### **II. OBJETIVO**

- Reconocer la utilidad de los medicamentos que actúan en el sistema nervioso autónomo.
- Comprender mediante casos clínicos las propiedades y características de los fármacos que actúan en el sistema nervioso autónomo.

### **III. FUNDAMENTO TEÓRICO**

La actividad del sistema nervioso autónomo se transmite por los nervios periféricos, si bien está sometida a fenómenos de control e integración que se elaboran principalmente en los centros nerviosos dentro del sistema nervioso central, estos centros especializados en el control de la actividad autónoma se encuentran sometidos a influencias múltiples de muy diversas áreas o núcleos del SNC.



Morfológicamente el sistema autónomo se divide en simpático y el parasimpático. Los centros nerviosos del simpático se encuentran en el asta intermediolateral de la médula espinal, desde el primer segmento dorsal hasta el segundo o tercero lumbar, de ahí parten las raíces eferentes o fibras preganglionares que conectan con células de los ganglios simpáticos prevertebrales y paravertebrales; Ambos sistemas poseen también abundantes fibras aferentes que recogen la sensibilidad de los distintos órganos. Las fibras preganglionares simpáticas y parasimpáticas poseen como neurotransmisor específico la acetilcolina, que ejecuta la transmisión por interacción con receptores colinérgicos nicotínicos. La mayoría de las fibras posganglionares simpáticas liberan noradrenalina, por lo que se las denomina adrenérgicas, mientras que las fibras colinérgicas suelen liberar la acetilcolina en las terminaciones neuronales, las adrenérgicas lo hacen en varicosidades que se encuentran a lo largo de las fibras, en su recorrido dentro del órgano que inervan.<sup>4</sup>

Las respuestas producidas por el sistema nervioso simpático y parasimpático en su mayoría son opuestas, como se aprecia en la tabla 2:

**Tabla 2. Funciones del sistema nervioso simpático y parasimpático.**

Órgano o sistema	Sistema nervioso parasimpático	Sistema nervioso simpático
Pupilas	Contracción (midriasis)	Dilatación (miosis)
Corazón	Disminución de la velocidad, contractilidad y conducción	Aceleración de la frecuencia cardiaca Incremento de la contractilidad y velocidad de conducción.
Bronquios	Contracción	Dilatación
Intestino	Aumento de motilidad y tono	Disminución de motilidad y tono
Riñon	No posee inervación	Incrementa secreción de renina
Hígado		Aumenta la glucogenolisis y gluconeogenesis
Vejiga	Relajación y contracción	Contrae esfinteres



Farmacológicamente se pueden utilizar agonistas y antagonistas de ambas porciones del autónomo, por ejemplo la utilización de antagonistas muscarínicos reducen la secreción de las mucosa nasal, faringolaríngea, traqueal y bronquial, lo cual es útil en catarros comunes y en la anestesia, ya que la aparición de laringospasmo parece estar muy asociada a la producción de secreciones en las vías respiratorias. Sin embargo, la depresión de la secreción mucosa y la inhibición de la depuración mucociliar son efectos perjudiciales en enfermos respiratorios. Producen relajación de la musculatura bronquial, debida principalmente al bloqueo de receptores M1, M3 y M5. Debido a la participación parasimpática refleja en la respuesta a un número variado de estímulos, los antimuscarínicos no sólo bloquean la broncoconstricción provocada por estimulación parasimpática sino también la provocada por histamina, bradiginina y prostaglandina F2a. <sup>9</sup>

#### IV. MATERIAL

- Vademécum Clínico
- Texto farmacología
- Guías de prácticas clínicas

#### V. PROCEDIMIENTO

Revise los siguientes casos y responda las preguntas:

##### **Caso 1:**

Paciente masculino de 30 años de edad y 75 kg de peso, bajo efectos residuales de sedación por un procedimiento de broncoscopia diagnóstica en el que se utilizó Midazolam y Fentanilo, el cual se encuentra aún somnoliento.



Éste presenta suministro de O<sub>2</sub> adicional por medio de puntas nasales a razón de 3L/min, con signos vitales dentro de parámetros normales y sin reporte de eventualidades, tiene un acceso venoso corto en miembro superior derecho; SaO<sub>2</sub>: 88% y cianosis periférica leve. Transcurridos unos minutos la SaO<sub>2</sub> sigue descendiendo gradual y continuamente, por lo que realiza una exploración minuciosa, encontrando ruidos respiratorios con sibilancias en 35 hemitorax derecho así como hipo ventilación basal del mismo lado, por lo que determina iniciar una micronebulización con Salbutamol.

Salbutamol: Vial x 10mL. Cada 100mL de solución contiene 0,5 g de salbutamol sulfato.

1. ¿Es normal la sedación residual por la utilización de Midazolam y fentanilo?. Explique en que consiste.
2. ¿Cuáles son las posibles causas del descenso de SaO<sub>2</sub>?
3. De acuerdo a la bibliografía existente, ¿cuál es la dosis de salbutamol que necesita este paciente?
4. ¿Cómo sería el cálculo y preparación del medicamento?
5. ¿Cuáles son las posibles reacciones adversas del medicamento?

### **Caso 2:**

Paciente femenina de 60 años de edad la cual refiere el familiar lleva varios días con “una fuerte infección respiratoria”, la cual se observa con disnea franca FR: >30rpm, cianosis generalizada, taquicardia: >110lpm y diaforesis, SaO<sub>2</sub> de 80%, por lo que se colocan puntas nasales a 3L/m, a la auscultación se encuentran velados los ruidos respiratorios del hemitorax izquierdo desde base hasta porción media, en el resto del tórax escucha estertores crepitantes generalizados, y ruidos cardiacos normales a expensas de la taquicardia. Los gases arteriales muestran un pH: 7.50, paCO<sub>2</sub>: 55mmHg, HCO<sub>3</sub>: 22meq PaO<sub>2</sub>: 80mmHg, SaO<sub>2</sub>: 85%.



Se determina iniciar ventilación mecánica no invasiva y el siguiente tratamiento farmacológico:

- MNB Bromuro de ipratropio/salbutamol 500µg/2.5 µg c/6h
- MNB Budesonida 200 µg c/6h
- MNB Sol. Salina 0.9% c/6
- Ceftriaxona 1g IV C/12h

1. De acuerdo a la bibliografía, ¿son correctas las dosis prescritas de ipratropio/salbutamol, budesonida y ceftriaxona?
2. Describa los mecanismos de acción de estos fármacos y el tiempo de vida media
3. ¿Cuáles son las principales reacciones adversas de los fármacos prescritos?
4. Como se prepararía el ipratropio/salbutamol teniendo en cuenta que en la institución se cuenta con envases de bromuro de ipratropio/salbutamol base 0.50mg/2.5mg en 2.5mL.
5. Analice las ventajas y desventajas de la vía respiratoria como vía de administración.

#### **VI. CUESTIONARIO:**

1. ¿Cuáles son las interacciones farmacológicas de relevancia clínica del ipratropio y salbutamol?
2. Describa el volumen de distribución, % de unión a proteínas plasmáticas, vías de eliminación de los fármacos prescritos
3. ¿Cuáles son las contraindicaciones y precauciones?



## PRÁCTICA Nº 8 ANTIHIPERTENSIVOS

### I. INTRODUCCIÓN

La Hipertensión Arterial (HTA) es uno de los principales problemas de salud pública en el mundo, constituyendo uno de los factores de riesgo de las enfermedades cardiovasculares y responsable de altas tasas de mortalidad. Para el manejo de la HTA se usan los diuréticos, antagonistas de los canales de calcio (ACC), inhibidores del sistema renina-angiotensina-aldosterona,  $\beta$ -bloqueadores (BB), entre otros, ya sea en monoterapia o combinados, por esta razón es fundamental que los estudiantes de medicina conozcan los fundamentos conceptuales y la relevancia clínicas de estos grupos farmacológicos.

### II. OBJETIVOS

- Reconocer la utilidad de los medicamentos que actúan en el sistema nervioso cardiovascular.
- Comprender mediante casos clínicos las propiedades y características de los fármacos que actúan en el sistema cardiovascular.

### FUNDAMENTO TEÓRICO

La tensión arterial (TA) es la fuerza que ejerce la sangre circulante contra las paredes de las arterias, esta varía de acuerdo a la actividad física, dieta y medicamentos que se consuman. Esta se representa mediante la presión que ejerce la sangre sobre los vasos cuando el corazón se contrae o late (tensión sistólica), y mediante la presión ejercida sobre los vasos cuando el corazón se relaja entre un latido y otro (tensión diastólica). La TA se clasifica en 4 niveles con base en la cifras promedio de TA Clínica: TA normal (TAS <120 Y TAD <80 mm Hg), elevada (TAS 120-129 y TAD <80 mm Hg) HTA grado 1 (TAS 130-139 O TAD 80-89 mmHg) y HTA grado 2 (TAS  $\geq$ 140 o TAD  $\geq$  90).



Entre los distintos tipos de HTA se encuentra la HTA esencial o primaria, en la cual no existe una etiología definida y corresponde aproximadamente al 90% de los casos, cuando la causa es corregible la hipertensión se denomina HTA secundaria, la cual ocurre en el 10% de los pacientes. La HTA esencial es un trastorno en el que influyen múltiples genes o combinaciones genéticas y sobre esta base genética, una serie de factores adquiridos o ambientales ejercen un efecto deletéreo para su progreso, entre estos factores destacan el sobrepeso y la obesidad, alto consumo de sodio y/o pobre de potasio en la dieta, sedentarismo e ingesta excesiva de alcohol.

Por otro lado las causas de HTA secundaria pueden ser hiperaldosteronismo primario, enfermedad renal parenquimatosa, síndrome de apnea-hipopnea del sueño, enfermedad renovascular o HTA inducida por fármacos o drogas, incluido el alcohol, las menos frecuentes son el feocromocitoma, el síndrome de Cushing, los distiroidismos, el hiperparatiroidismo, la coartación de aorta y varios síndromes de disfunción suprarrenal distintos a los anteriores.<sup>5</sup>

Las modificaciones en el estilo de vida de los pacientes constituyen la base de la prevención y del tratamiento de la HTA y, consiguientemente, de la reducción del RCV asociado, tanto a nivel individual como en la comunidad se considera que estas medidas son prioritarias para la prevención de la HTA y de sus complicaciones. En caso de no lograr controlar la HTA debe recurrirse a tratamiento farmacológico, entre los grupos terapéuticos utilizados destacan los calcioantagonistas, Inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina (IECA), antagonistas de receptores de angiotensina II (ARA II) como de primera línea de tratamiento; en caso que los pacientes estén con HTA grado 2 se comenzará el tratamiento con una combinación de 2 fármacos de primera línea de diferentes clases.<sup>10</sup>

### **III. MATERIALES**



- Vademécum Clínico
- Texto farmacología
- Guías de prácticas clínicas

#### **IV. PROCEDIMIENTO**

##### **Caso 1**

Paciente masculino de 58 años de edad, diagnosticado con hipertensión desde hace 3 años medicado con Enalapril 20mg /24h, y Metoprolol 50mg/12h, al momento del ingreso lo revisa y encuentra que tiene sobrepeso, está alerta pero manifiestas confusión temporo espacial, diaforético, refiriendo cefalea intensa, visión borrosa y zumbido de oídos, la frecuencia cardiaca es: 120lpm y presión arterial: 200/115mmHg, la frecuencia respiratoria es 20 TC: 36°.

1. Mencione los potenciales problemas
2. Cuáles son las posibles causas de estos problemas?
3. Cuáles son las principales complicaciones del paciente de acuerdo a lo descrito?
4. Analice el tratamiento farmacológico prescrito y determine: indicaciones generales, mecanismos de acción, vida media de los efectos, dosis recomendadas y principales efectos colaterales esperados de cada medicamento.
5. Analice las dosis prescritas y las dosis recomendadas
6. Proponga alternativas farmacológicas y no farmacológicas de tratamiento

##### **Caso2:**



Paciente femenina de 63 años de edad, que ingresa a la urgencia por dolor torácico opresivo que se irradia a espalda y hombro izquierdo, el cual empezó mientras dormía y que no ha disminuido pese a tomar 1g de acetaminofén vía oral.

Al revisarlo encuentra que la frecuencia cardiaca es 118 latidos por minuto, presión arterial: 100/70mmHg, frecuencia respiratoria de 18, SaO<sub>2</sub>: 88%, posteriormente y se le prescriben lo siguiente:

- Oxígeno 5l/min
  - Ácido acetil salicílico 100mg VO/24h
  - Dinitrato de Isosorbide 10mg VO/24h
  - Morfina 2 mg IV
  - Sol. Salina 0.9% 250ml IV/24h
1. Determine los efectos farmacológicos de cada uno de los fármacos prescritos incluyendo: indicaciones, contraindicaciones, dosis, mecanismo de acción.
  2. Mencione cuales son las vías de administración ideales de acuerdo al caso
  3. Indique las posibles complicaciones o efectos adversos del tratamiento establecido
  4. Mencione qué alternativas farmacológicas podrían utilizarse

## V. CUESTIONARIO

1. ¿Cuáles son las indicaciones del isosorbide y ácido acetil salicílico?
2. De los fármacos prescritos mencione el volumen de distribución, % de unión a proteínas plasmáticas, vías de eliminación
3. ¿Cuáles son las reacciones adversas, contraindicaciones y precauciones?



## PRÁCTICA Nº 9

### MANEJO DE ANTICOAGULANTES Y ANTIAGREGANTES PLAQUETARIOS

#### I. INTRODUCCIÓN

Los fármacos anticoagulantes se utilizan para prevenir y tratar la enfermedad tromboembólica, se dividen según su acción en directos o indirectos, su administración se puede realizar por vía parenteral (subcutánea o endovenosa) para tener con rapidez un estado hipocoagulante, o por vía oral para lograr un efecto de mantenimiento, entre los más utilizados se encuentran las heparinas y derivados cumarínicos aunque también se encuentran los nuevos anticoagulantes orales.

La anticoagulación oral con inhibidores de vitamina K (derivados cumarínicos) sigue dominando el tratamiento y prevención de trombosis venosa profunda y enfermedad trombo-embólica, aunque tienen limitaciones como un estrecho margen terapéutico o gran variabilidad interindividual, lo que obliga a monitorizar periódicamente el INR. Sin embargo los nuevos anticoagulantes orales se han utilizado con mayor frecuencia en la clínica debido a que tienen comportamiento más predecible, mayor rango terapéutico, por lo que no es necesaria la monitorización. Otra de las terapias usadas extensamente en pacientes con riesgos cardiovasculares son los antiagregantes plaquetarios, los cuales son fármacos utilizados para la prevención de trombos en situaciones como: riesgo de episodios obstructivos coronarios y cerebrales, cirugía vascular, diálisis, trombosis venosas profundas. Los antiagregantes plaquetarios pueden clasificarse en función de las fases de la agregación en las que actúan, pero entre los más utilizados en clínica se encuentran el clopidogrel y el ácido acetil salicílico.



## II. OBJETIVOS

- Reconocer la utilidad de la Heparina y otros anticoagulantes
- Comprender mediante casos clínicos las propiedades y características Heparina y otros anticoagulantes.

## III. FUNDAMENTO TEÓRICO

La heparina es un glucosaminoglucano que se encuentra en los gránulos secretores de las células cebadas, esta actúa de manera indirecta al potenciar cerca de 1000 veces el efecto de la Antitrombina III (AT), una proteasa hepática que de manera aislada es un inhibidor débil de la trombina (factor IIa) y de otros factores. El complejo heparina-AT actúa sobre los factores de coagulación IIa, IX, Xa, XI, XII, calicreina.

El mencionado complejo actúa por tres mecanismos: en el primero una secuencia de pentasacáridos de la heparina se unen a la antitrombina, dando como resultado un cambio conformacional que potencia la inhibición del factor Xa. Para ejercer el efecto sobre la trombina y el factor Xa, la heparina debe tener al menos 18 residuos sacáridos que facilitan la unión a la antitrombina y al factor IIa. El segundo mecanismo se da por el alejamiento de los factores de la coagulación que tienen carga positiva, debido a la positividad del centro catalítico de la antitrombina, lo cual está estrechamente relacionado con que la cadenas largas de heparina cargadas negativamente aumentan la acción inhibitoria de la antitrombina sobre la trombina.

11

Finalmente, en el tercer mecanismo ocurre el acercamiento de las moléculas de trombina al sitio activo de la antitrombina. La trombina será inactivada por la heparina en un mecanismo en el que participa el cofactor de II heparina, todo esto dependerá de la carga, concentración y entre sus características se encuentra el



requerimiento de una cadena mínima de 24 sacáridos independiente de la secuencia específica de pentasacaridos.

Otro de los mecanismos anticoagulantes es mediado por concentraciones elevadas de heparina que provocan la liberación del factor inhibidor del factor tisular e inhibidor del activador del plasminogeno tipo I. Las heparinas de bajo peso molecular tienen una alta biodisponibilidad, una larga vida media y no requieren monitorización frecuente, lo que hace que su utilización sea más segura en tratamiento o profilaxis de la trombosis venosa profunda y tromboembolismo venoso.

Por otro lado el clopidogrel es un profármaco, que después de ser activado se encargará de inhibir selectivamente la unión del adenosindifosfato (ADP) a su receptor plaquetario P2Y<sub>12</sub> y la activación del complejo GPIIb-IIIa mediada por ADP. Debido a esta unión irreversible la recuperación de la función plaquetaria dependerá del grado de renovación de las plaquetas.<sup>12</sup>

#### **IV. MATERIALES**

- Vademécum Clínico
- Texto farmacología
- Guías de prácticas clínicas

#### **V. PROCEDIMIENTO**

##### Caso 1

Paciente masculino de 41 años y 84kg de peso, quien será sometido a cirugía programada el día de mañana, por lo que se mantiene sin soluciones intravenosas. El paciente le refiere que hasta hoy en la mañana continuaba tomando los siguientes medicamentos:

- Clopidogrel 75mg/ VO día



- ASA 100mg/vo día
- Atorvastatina 40mg/vo día.

### **Caso 2**

Paciente masculino de 34 años con diagnóstico de infarto agudo al miocardio de menos de 3 horas de evolución, a quien se le realizará terapia de reperfusión en sala de hemodinamia, mientras ingresa se le prescribe:

- Heparina NF 5000UI IV DU
- DAD5% 250ml+ 25000 UI de Heparina NF IV iniciar a 80UI/h

De los casos anteriores:

1. ¿Cuáles son los factores de riesgo según los fármacos prescritos?
2. De los fármacos prescritos mencione el volumen de distribución, % de unión a proteínas plasmáticas, vías de eliminación
3. ¿Cuáles son las reacciones adversas, contraindicaciones y precauciones?



## PRÁCTICA Nº 10 MANEJO DE INSULINA

### I. INTRODUCCIÓN

La insulina es una hormona que segregada por las células  $\beta$  ubicadas en los islotes de Langerhans del páncreas, principalmente como respuesta a la presencia de glucosa en sangre y, en menor grado, de otras sustancias contenidas en los alimentos. Esta es fundamental en la homeostasis del organismo, por tal razón es importante que los estudiantes del área de la salud, en especial de medicina conozcan sus características y para que le den un buen manejo.

### II. OBJETIVOS

- Reconocer la utilidad de la insulina y otros hipoglicemiantes
- Comprender mediante casos clínicos las propiedades y características la insulina y otros hipoglicemiantes.

### III. FUNDAMENTO TEÓRICO

La glucosa estimula la liberación de insulina después de ingresar a la célula por medio de un transportador GLUT, este está asociado a una glucocinasa, la cual fosforilará la glucosa por lo que funciona como sensor para la liberación de insulina. Los pacientes pueden ser insulinizados al inicio de la enfermedad si hay presencia de cetonuria intensa, pérdida de peso, u otros síntomas indicadores de diabetes, tal como la HbA1c > 9%, también pueden ser insulinizados durante el seguimiento.

El inicio de la insulinización puede realizarse de distintas maneras, una es teniendo en cuenta la insulina basal: Una o 2 dosis de insulina NPH, o una dosis de análogo basal glargina, detemir y degludec. Esta es la opción de elección, dependiendo el ajuste de las dosis de las glucemias basales medidas cada tres días Si en 3 meses



no se consiguen los objetivos glucémicos con insulinas basales a dosis superiores de 0,5 U/kg, debe intensificarse la terapia. En pacientes con glucemia basal > 280-300 mg/dl o cetonuria, pueden utilizarse dos dosis de insulina basal, una pauta bifásica o un tratamiento basal-bolo. Otra forma es teniendo en cuenta la Insulina prandial, utilizando 3 dosis de análogos de acción rápida o ultrarrápida antes de las comidas, o mezclando estas con una de acción intermedia.<sup>13</sup>

La decisión de suspender o cambiar la insulina por otros antidiabéticos dependerá de variables como:

- a) Si la insulina fue administrada durante el ingreso hospitalario o por algún proceso que provocó aumento de la glucosa y la glicemia estaba controlada previamente con otros antidiabéticos.
- b) Si la administración de dosis fijas de insulina desde el inicio produjo buen control de glicemia.
- c) Si la glicemia estuvo controlada con dosis bajas de insulina y el paciente ha tenido la enfermedad menos de 10 años

Si en tres o cuatro meses no se controla la glicemia con dosis superiores de 0,5 U/kg de insulinas basales, se debe intensificar la terapia. En pacientes con muchos síntomas y niveles de glicemia superior a 280-300 mg/dl o cetonuria, se debe pensar en la administración de 2 dosis de insulina basal, el cual podría ser un esquema bifásico o uno basal-bolo.

Para la suspensión del tratamiento con insulina hay que ser cuidadoso y llevar un control estricto de los niveles de glucosa en sangre, sin embargo es posible, en otros casos puede ser sustituida por otros antidiabéticos.<sup>14</sup>



#### **IV. MATERIALES**

- Vademécum Clínico
- Texto farmacología
- Guías de prácticas clínicas

#### **V. PROCEDIMIENTO**

##### **Caso 1:**

Paciente masculino de 43 años de edad, diagnosticado con Diabetes Mellitus tipo 2, la última glucometría en ayuno arroja un resultado de 245g/dL, de acuerdo a esto tiene indicado el siguiente esquema de Insulina aspart:

- 140-180 g/dL:2UI
- 181-220 g/dL:4UI
- 221-260 g/dL:6UI
- 261-300 g/dL:8UI
- >300g/dL:10UI

##### **Del caso anterior:**

- Determine las posibles causas de la hiperglicemia.
- Mencione cuales son las medidas de conservación de la insulina.
- Describa las propiedades farmacológicas de la Insulina rápida: indicaciones, contraindicaciones, dosis, mecanismo de acción, vida media, reacciones adversas.
- Menciones cuales son las posibles alternativas de tratamiento.
- Realice el cálculo de la dosis teniendo en cuenta que en la institución se cuenta con un vial de 10mL (equivalente a 3.5mg), cuya concentración es 100UI/mL y con flexpen que contiene precargada 300UI en 3mL (equivalente a 3.5mg).

##### **Caso 2:**



Paciente femenino de 37 años de edad y 68kg de peso, diagnosticada desde hace 9 años con diabetes tipo I, de la que se sospecha enfermedad neuropática periférica no específica. La paciente manifiesta que recibió metilprednisolona 1g IV la noche anterior, al recibir la glucometria preprandial encuentra valores de 260g/dL, además tiene indicado el siguiente esquema:

- Insulina aspart al 2% mayor a 180g/dl
- Insulina NPH via subcutánea, 12 UI am y 8UI pm

#### **Del caso anterior:**

- Determine las posibles causas de la hiperglicemia.
- Mencione las medidas de conservación de la insulina.
- Describa las propiedades farmacológicas de la Insulina rápida: indicaciones, contraindicaciones, dosis, mecanismo de acción, vida media, reacciones adversas.
- Menciones cuales son las posibles alternativas de tratamiento.
- Realice el cálculo de la dosis teniendo en cuenta que en la institución se cuenta con un vial de 10mL (equivalente a 3.5mg), cuya concentración es 100UI/mL y con flexpen que contiene precargada 300UI en 3mL (equivalente a 3.5mg).

#### **VI. CUESTIONARIO**

1. Realice un cuadro comparativo de insulinas de acción rápida, intermedia y lenta
2. De los fármacos prescritos mencione el volumen de distribución, % de unión a proteínas plasmáticas, vías de eliminación
3. ¿A qué se denomina esquema móvil de corrección de insulina?



## PRÁCTICA Nº 11

### FÁRMACOS ANTIEMÉTICOS

#### I. INTRODUCCIÓN

Al hablar de los mecanismos que provocan el vómito, se debe tener en cuenta los impulsos procedentes de la zona quimiorreceptora, aparato vestibular, sistema límbico, receptores intracraneales, tracto gastrointestinal, como también de la intervención de los receptores colinérgicos, histaminérgicos, dopaminérgicos y serotoninérgicos. Por estas razones existe un número representativo de fármacos que bloquean gran variedad de receptores que ejercen una acción antiemética que son trascendentales conocerlos para proporcionar una terapia racional, principalmente en estudiantes de medicina, por tal razón se revisaran los principales fármacos antieméticos y su utilización en terapéutica.

#### II. OBJETIVOS

- Reconocer la utilidad de los fármacos antieméticos
- Comprender mediante casos clínicos las propiedades y características farmacológicas de los fármacos antieméticos

#### III. FUNDAMENTO TEÓRICO

Para tratar y prevenir las náuseas y vomito pueden existe una gran variedad de fármacos que pueden combinarse para buscar sinergismo (tabla 3):



**Tabla 3. Clasificación de fármacos antieméticos**

<b>CLASE DE ANTIEMÉTICO</b>	<b>EJEMPLOS</b>	<b>TIPO DE VÓMITOS MÁS EFICACES CONTRA</b>
Antagonistas del receptor 5-HT <sub>3</sub>	Ondansetrón	Emesis inducida por fármacos citotóxicos
Antagonistas del receptor de dopamina de acción central	Metoclopramida Prometazina	Emesis inducida por fármacos citotóxicos acción central
Antagonistas del receptor H <sub>1</sub> de histamina	Ciclizina	Vestibular (cinetosis)
Antagonistas del receptor muscarínico	Hioscina (escopolamina)	Cinetosis
Agonistas de receptor opioide	Dronabinol	Emesis inducida por fármacos citotóxicos

Entre los fármacos más utilizados se encuentra la metoclopramida, cuya acción farmacológica provoca efectos antiemético y procinético, esta es efectiva en el tratamiento de las náuseas y el vómito provocados por cirugía, trastornos gastrointestinales, quimioterapia, radioterapia; también está indicada para el reflujo gastroesofágico, gastroparesia, entre otros, aunque no funciona para el mareo del viajero.

Entre los efectos adversos se encuentran el extrapiramidalismo y las reacciones distónicas agudas, las cuales son más frecuentes en jóvenes y pacientes de edad avanzada; aparecen poco después del inicio del tratamiento y disminuyen en las 24 horas de la retirada del fármaco.<sup>15</sup>

La prometazina es una fenotiacina que ejerce un bloqueo dopaminérgico D<sub>2</sub> en el SNC, aunque también se han reportado efectos sobre los receptores muscarínicos e histaminérgicos. Es eficaz en la prevención y tratamiento del vértigo, mareo del viajero, vómitos inducidos por fármacos. Sin embargo tiene un efecto limitado sobre los vómitos producidos por quimioterapia o radioterapia.



El ondansetrón es un antiemético con acción antagonista selectiva y potente sobre los receptores de la serotonina, que carece de actividad sobre los receptores dopaminérgicos, por tal razón no produce efectos extrapiramidales y a su vez, no es eficaz sobre las náuseas y vómitos provocados por mareo del viaje. Este fármaco es sumamente eficaz en el tratamiento de las náuseas y vómitos inducidos por citostáticos. Su actividad está ligada al antagonismo selectivo de los

receptores 5HT-3, estos se encuentran presentes en el área postrema de los terminales nerviosos centrales y periféricos, en la zona gatillo de los quimiorreceptores. Aunque los efectos antieméticos del ondansetrón pueden ser

una combinación de efectos en el sistema nervioso central y periférico, frente al cisplatino el efecto está claro, debido a que este citostático provoca una liberación de serotonina por las células enterocromafinas, por lo que el ondansetrón al inhibir esta serotonina, actuaría como antiemético.<sup>4</sup>

Por otro lado, la ciclizina es un antihistamínico utilizado por vía oral y parenteral para prevenir y tratar las náuseas y vómitos producidos por cinetosis. Su acción se da por el bloqueo de los receptores H1 sin unirse de acetilcolina, entre sus efectos adversos, como los antihistamínicos de primera generación, deprime el sistema nervioso central provocando sueño.<sup>16</sup>

#### **IV. MATERIAL**

- Vademécum Clínico
- Texto farmacología
- Guías de prácticas clínicas



## V. PROCEDIMIENTO

### Caso 1:

Paciente masculino pediátrico de 10kg de peso, que padece de infección de vías respiratorias bajas, el cual después de ser amamantado comienza con un cuadro de tos productiva importante tornándose cianótico; posteriormente presenta vómitos de contenido alimentario, por lo que se prescribe Metoclopramida 0.10mg/kg IM. Después de transcurrido los primeros minutos de la medicación el paciente se observa inquieto y comienza a presentar movimientos clónicos de las extremidades inferiores, así como protrusión repetida de la lengua. Para el caso anterior:

- Determine las posibles causas del problema o problemas.
- Determine aspectos farmacológicos de los fármacos prescritos: indicaciones, dosis, mecanismos de acción, vida media y eliminación de cada medicamento prescrito.
- Realice el cálculo de la dosis prescrita sabiendo que en la institución se cuenta con ampollas cuya concentración es 10mg/2mL.
- Analice las reacciones adversas presentadas por el paciente y mencione cual es la causa y el tratamiento.
- Mencione cuales son las alternativas farmacológicas.

Paciente de 48 años de edad y 87kg de peso, el cual únicamente se encuentra recibiendo SSN0.9% a 40mL/h y morfina a dosis no especificadas. De manera súbita el paciente comienza con náuseas y vómito de contenido gastro-biliar por lo que se prescribe Metoclopramida 10mg IV c/8h. Aparentemente el paciente presenta respuesta favorable al medicamento por unos minutos, pero después de un momento el paciente persiste nauseoso hasta llegar de nuevo al vómito, cambiando la prescripción a Ondansetrón 8mg IV. Del caso anterior:

- Determine las posibles causas del problema o problemas.



- Determine aspectos farmacológicos de los fármacos prescritos: indicaciones, dosis, mecanismos de acción, vida media y eliminación de cada medicamento prescrito.
- Calcule la velocidad de infusión en gotas/minuto, sabiendo que en la institución se cuenta con ampollas de ondansetrón cuya concentración es 4mg/2mL, SSN0.9% X 100mL y la infusión se realizará en en 15 minutos.
- Analice las reacciones adversas presentadas por el paciente y mencione cual es la causa y el tratamiento.
- Mencione cuales son las alternativas farmacológicas.

## **VI. CUESTIONARIO**

1. Que otros fármacos antieméticos son utilizados en clínica.
2. De los fármacos prescritos mencione el volumen de distribución, % de unión a proteínas plasmáticas, vías de eliminación y dosis usuales en adultos y niños.
3. ¿Cuáles son las interacciones farmacológicas más relevantes en la clínica de los antieméticos?



## PRÁCTICA Nº 12 ANTIHISTAMÍNICOS

### I. INTRODUCCIÓN

La histamina es un neurotransmisor responsable de gran variedad de respuestas fisiológicas y/o patológicas en diferentes tejidos, como reacciones alérgicas, inflamación, secreción ácido-gástrica, y de otros procesos a nivel central y periférico. Esta es una amina primaria que se encuentra ampliamente distribuida y almacenada en forma inactiva en los mastocitos tisulares y leucocitos circulantes que suele ser liberada ante la presencia de toxinas o daño epitelial provocando dilatación de los vasos sanguíneos o incluso edema por extravasación de líquidos y proteínas plasmáticas. Por tales motivos es pertinente para los estudiantes de la salud, especialmente medicina reconocer el papel de los fármacos antihistamínicos en la clínica.

### II. OBJETIVOS

- Reconocer la utilidad de los fármacos antihistamínicos.
- Comprender mediante la búsqueda de información las propiedades y características farmacológicas de los fármacos antihistamínicos.

### III. FUNDAMENTO TEÓRICO

En el tracto gastrointestinal la ranitidina (antagonista del receptor H<sub>2</sub>) se absorbe rápidamente después de su administración por vía oral, alcanzando las máximas concentraciones séricas entre 1-3 h. El efecto terapéutico se conserva durante 6 a 8 horas. Tiene una baja unión a proteínas plasmáticas cuando son comparados con los inhibidores de la bomba de protones, y el metabolismo completo se produce en el 10-35% de los miembros de este grupo, siendo el hígado el principal órgano encargado de tal función, por tal motivo, si existe afección hepática debe realizarse ajuste de dosis, la eliminación es a nivel renal, principalmente en forma de



metabolitos mediante los procesos de filtración glomerular y secreción tubular, por lo que una disfunción renal también requerirá el ajuste de dosis. Hay que resaltar que los antagonistas de no suprimen la secreción gástrica, pero sí las secreciones salival, lagrimal y exocrina de otro tipo inducidas por la histamina.

A nivel vascular, los antagonistas histaminérgicos (principalmente los que actúan sobre receptores H1) inhiben la vasoconstricción provocada por la histamina, pero también los efectos vasodilatadores mediados por la activación de los receptores H1 en las células endoteliales (síntesis o liberación de óxido nítrico y otros mediadores). La vasodilatación residual manifiesta la participación de los receptores H2 en el músculo liso y puede suprimirse sólo por la administración de antagonista de estos últimos. Los antagonistas H1 disminuyen la permeabilidad capilar, la formación de edema y pápulas desencadenados por la histamina, en las terminaciones nerviosas la histamina puede provocar eritema y prurito, por tal razón los antagonistas (principalmente de receptores H1) los suprimen.<sup>17</sup>

Algunos de los antagonistas H1 de primera generación disminuyen las reacciones de la acetilcolina mediadas por receptores muscarínicos; entre todos los fármacos con esta actividad, la prometazina es la que posee la máxima actividad de bloqueo muscarínico, constituyéndose como el más eficaz para combatir la cinetosis. La reacción adversa más frecuente de los antagonistas H1 de primera generación es la sedación, en algunas situaciones este es un efecto deseable, aunque en otros pacientes puede interferir en las actividades de rutina. Otros efectos son mareo, insomnio, fatiga, visión borrosa o temblores. En la tabla 4 se encuentran los antagonistas histaminérgicos de primera y segunda generación y su actividad en los receptores colinérgicos.<sup>6,17</sup>



**Tabla 4. Antagonistas histaminérgicos**

<b>Primera Generación</b>	<b>Sedación</b>	<b>Efecto anticolinérgico</b>
Clorfeniramina	++	++
Difenhidramina	+++	+++
Dimenhidrinato	+++	+++
Hidroxizina	+++	++
Prometazina	+++	+++
<b>Segunda generación</b>		
Astemizol	-	-
Cetirizina	+	-
Loratadina	+	-
Desloratadina	-	-

#### **IV. MATERIAL**

- Vademécum Clínico
- Texto farmacología
- Guías de prácticas clínicas

#### **V. PROCEDIMIENTO**

##### **Caso 1:**

Paciente femenina de 51 años de edad a la que se transfunde 1 unidad de Plasma Fresco en 30 minutos. Se comprobó el grupo rh y realizó la transfusión sin aparentes eventualidades, pero unos minutos antes de terminar la unidad, la paciente comienza a referir calor, ansiedad, ruboración facial y pequeñas zonas eritematosas en cuello y tórax. Se suspende el resto de la transfusión y se prescribe Ranitidina 300mg IV DU e Hidrocortisona 100mg IV DU. Del caso anterior:

- Determine las posibles causas del problema o problemas.
- Determine los siguientes aspectos farmacológicos de los fármacos prescritos: indicaciones, dosis, mecanismos de acción, vida media y eliminación de cada medicamento prescrito.



- Analice las reacciones adversas presentadas por el paciente y mencione cual es la causa y el tratamiento.
- Mencione cuales son las alternativas farmacológicas.

### **Caso 2:**

Paciente masculino de 26 años de edad, con diagnóstico de masa mediastinal en estudio, al que se le realizará TAC contrastado de tórax, por lo que se le administran 100mL de medio de contraste a base de yodo intravenoso, al instante el paciente comienza a sentirse ansioso, se observa diaforético y rubicundo no colabora con el estudio e intenta levantarse de la mesa, cuando usted ingresa al cuarto de imagen le observa además que el paciente tiene edema facial, además de dificultad respiratoria y estridor laríngeo. En el servicio se cuenta con atropina ampolla 1mg, adrenalina ampolla de 1mg, Midazolam ampolla 15mg, fentanilo ampolla 0.5mg, Vecuronio ampolla 4mg, hidrocortisona 100 y 500 mg ampolla, Metilprednisolona ampolla 500mg, ampolla clorfeniramina 10mg, agua inyectable y SSN 0.9% 250mL, sol. Hartman 500ml, laringoscopio con una hoja curva no. 3, sondas orotraqueales y orofaríngeas, y jeringas de tamaños 3-10mL. Del caso anterior:

- Determine las posibles causas del problema o problemas.
- Determine aspectos farmacológicos de los fármacos prescritos: indicaciones, dosis, mecanismos de acción, vida media y eliminación de cada medicamento prescrito.
- Determine y seleccione el tratamiento inmediato para revertir el cuadro clínico
- Analice las reacciones adversas presentadas por el paciente y mencione cual es la causa y el tratamiento.
- Mencione cuales son las alternativas farmacológicas.

## **VI. CUESTIONARIO**



1. Realice un cuadro comparativo entre shock anafiláctico, cardiogénico, hipovolémico y séptico.
2. De los fármacos prescritos mencione el volumen de distribución, % de unión a proteínas plasmáticas, vías de eliminación
3. ¿Cuáles son las interacciones farmacológicas de los antihistamínicos más relevantes en la clínica?



## PRÁCTICA Nº 13

### ANALGÉSICOS ANTIINFLAMATORIOS NO ESTEROIDEOS

#### I. INTRODUCCIÓN

Según la asociación internacional para el estudio del dolor (IASP por sus siglas en ingles), se ha definido el dolor como una “experiencia sensitiva y emocional desagradable que se asocia a una lesión tisular real o posible, o que se describe como tal” cuya función es crear una alerta que desencadenará respuestas protectoras como retirada motora refleja o asumir conductas ante el fenómeno que lo desencadeno, aunque tratando de mantener la lesión tisular al mínimo. Cuando la lesión no puede ser evitada, se producirá una respuesta molecular en el sistema nervioso central y periférico que permite la percepción del dolor, en varios de los puntos de la vía de transmisión del dolor se pueden utilizar fármacos que permiten su modulación, entre los más importantes se encuentran los analgésicos antiinflamatorios no esteroideos (AINES), por lo que resulta de vital importancia que los estudiantes del área de la salud, principalmente de medicina, reconozcan su utilidad en la terapéutica.

#### II. OBJETIVOS

- Reconocer la utilidad de los analgésicos opioides y antiinflamatorios no esteroideos.
- Comprender mediante casos clínicos las propiedades y características farmacológicas de los analgésicos opioides y antiinflamatorios no esteroideos.

#### III. FUNDAMENTO TEÓRICO

##### **Antiinflamatorios no esteroideos**

Los fármacos analgésicos no esteroides (AINES) son un grupo de sustancias heterogéneas cuyo efecto primario es impedir la síntesis de prostaglandinas mediante la inhibición de la enzima cicloxigenasa (COX), por tal motivo comparten



acciones farmacológicas y algunas reacciones adversas. En la tabla 5 se muestra su clasificación:

**Tabla 5. Clasificación de los AINES**

<b>De carácter ácido</b>	<b>De carácter no ácido</b>
Baja potencia y rápida eliminación: - Salicilatos: Ácido acetil salicílico, ácido salicílico. - Ácidos arilpropionicos: ibuprofeno - Ácidos antranilicos: ácido mefenamico, ácido niflúmico	Baja potencia y rápida eliminación - Derivados Anilínicos: Paracetamol (Considerado que no pertenece a los AINES)
Alta potencia y rápida eliminación: - Ácidos arilpropionicos: Ketoprofeno, flubiprofeno. - Ácidos arilaceticos: Diclofenaco, indometacina, ketorolaco - Oxicam: Lornoxicam	Baja potencia y eliminación intermedia - Derivados pirazolónicos y pirazolidindiónicos:
Potencia intermedia, eliminación intermedia: - Salicilatos: Diflunisal - Ácido arilpropiónico: Naproxeno - Ácido arilacético: 6MNA, metabolito de nabumetona.	Potencia intermedia y eliminación intermedia: - Derivados Coxib: Celecoxib
Alta potencia, lenta eliminación Oxicams: meloxicam, piroxicam, tenoxicam	Alta potencia y eliminación intermedia: - Derivados Coxib: Rofecoxib

Sin embargo se hace más practico realizar la clasificación de acuerdo al grado de inhibición de las enzimas COX-1 y COX-2, de acuerdo a esto existen tres grandes grupos:<sup>4,5</sup>

1. AINES inhibidores selectivos de la COX2 o COXIB, que se caracterizan por una menor toxicidad gastroduodenal.
2. AINES inhibidores intermedios de la COX-2 (nabumetona y meloxicam).
3. AINES clásicos o no selectivos de la COX-2, con inhibición de ambas enzimas (el resto de AINES).



Como se ha mencionado, la inhibición de la ciclooxigenasa es el mecanismo que evita la formación de mediadores proinflamatorios a nivel periférico y central, impidiendo la transformación de ácido araquidónico en prostaglandinas, prostaciclina y tromboxano. Las dos formas de la ciclooxigenasa tienen características definidas:

- a. COX-1: Es una enzima constitutiva que se encuentra en la mayoría de los tejidos, entre sus acciones se encuentra regular procesos como la protección gástrica, agregación plaquetaria, función renal y la homeostasis vascular. Por tanto su inhibición puede provocar efectos secundarios a estos niveles.
- b. COX-2. Esta enzima habitualmente no se detecta en los tejidos y aparece de forma inducida en estados de inflamación. Su expresión se inhibe por todos los AINE y también por los corticoides. Los denominados AINEs selectivos provocan menos efectos secundarios, especialmente los gastrointestinales.

Los AINES son antipiréticos, analgésicos y antiinflamatorios, en la analgesia se emplean para tratar el dolor leve o moderado. Su eficacia es inferior que la de los opioides, pero la ventaja es que no generan depresión respiratoria ni dependencia física. Dolores crónicos derivados de cirugías o inflamación se controlan satisfactoriamente, mientras que el originado en una víscera no, exceptuando el provocado por la menstruación. El AAS consigue la inactivación del 97% de la COX-1 por un periodo de 24h, mientras que los otros AINEs lo hacen de manera reversible. Como las plaquetas no pueden realizar síntesis proteica y por lo tanto la actividad enzimática, y su inhibición se prolonga durante toda la vida.<sup>18</sup>

Entre las principales reacciones adversas más comunes de los AINEs están el dolor abdominal, náuseas, anorexia, úlceras gástricas, anemia, diarrea, retención de sodio y agua.

#### **IV. MATERIALES**



- Vademécum Clínico
- Texto farmacología
- Guías de prácticas clínicas

## **V. PROCEDIMIENTO**

- Realizar una lista de los 10 analgésicos antiinflamatorios no esteroideos más utilizados.
- De los fármacos anteriormente descritos buscar: indicaciones, dosis, mecanismos de acción, vida media y eliminación de cada medicamento.

## **VI. CUESTIONARIO**

1. ¿Cuál es el mecanismo de acción de los inhibidores de la COX 2 y sus acciones farmacológicas?
2. ¿Cuáles son las reacciones adversas de los AINEs y de los inhibidores selectivos de la COX 2?. Realizar cuadro comparativo entre los mismos.
3. Dibuje el mecanismo antiagregante plaquetario del AAS
4. ¿Cuáles son los fármacos de elección para tratar: dolor leve o moderado, dolor intenso, dolor e inflamación, fiebre?



## PRÁCTICA N°14 HIPNÓTICOS y SEDANTES

### I. INTRODUCCIÓN

Los trastornos del sueño constituyen un problema grave y constante en la población, que afecta de forma negativa su calidad de vida, por esta razón los hipnóticos se ha convertido en uno de los grupos farmacológicos prescritos con mayor frecuencia. Por muchos años los medicamentos más utilizados para tratar los trastornos del sueño han sido las benzodiazepinas, sin embargo, su abuso ha traído consigo graves problemas como la dependencia y efectos adversos serios en el sistema nervioso central.

Por otra parte los fármacos sedantes son utilizados para disminuir la excitación y actividad del sistema nervioso central que permita calmar al paciente, algunos de estos pueden preservar la facultad de despertar de forma espontánea, por lo que se ha denominado “sedación consciente”, mientras que otros producen una pérdida de reacción ante a estímulos (“sedación profunda”). Aunque se dice que este grupo puede disminuir la percepción del dolor al disminuir la ansiedad y la aprehensión, carecen de actividad intrínseca analgésica, por lo que no son sustitutos de los analgésicos. Al ser grupos terapéuticos de mucho cuidado, se hace necesario que los estudiantes del área de la salud, principalmente de medicina, reconozcan su utilidad en la terapéutica.

### II. OBJETIVOS:

- Reconocer la utilidad de los sedantes e hipnóticos.
- Comprender mediante casos clínicos las propiedades y características farmacológicas de los sedantes e hipnóticos.



### III. FUNDAMENTO TEÓRICO

#### **Benzodiazepinas**

Este grupo farmacológico produce acciones en el SNC, los de mayor importancia son hipnosis, sedación, relajación muscular, disminuyen la ansiedad, producen

amnesia anterógrada y actividad anticonvulsiva; a nivel periférico algunas de ellas provocan vasodilatación coronaria, después de su administración intravenosa, y bloqueo neuromuscular, que ocurre sólo con las dosis muy altas.

Los usos terapéuticos de las benzodiazepinas dependen del tiempo de vida media, los que poseen un tiempo largo se utilizan como anticonvulsivantes, para que sean eficaces en el tratamiento del estado epiléptico deben penetrar con rapidez la barrera hematoencefálica y llegar a cerebro. Los que son utilizados como hipnóticos tienen un tiempo de vida media corto, lo que puede favorecer a que su utilice excesivamente produciendo síndrome abstinencia cuando es interrumpida abruptamente su administración. En la tabla 6 se muestran algunas benzodiazepinas y sus aplicaciones terapéuticas.<sup>4</sup>

**Tabla 6. Aplicaciones terapéuticas y duración de la acción de las benzodiazepinas.**

<b>Nombre</b>	<b>Aplicaciones terapéuticas</b>	<b>Horas</b>
Alprazolam	Trastornos de ansiedad, agorafobia	12 ± 2
Clonazepam	Trastornos convulsivos, tratamiento auxiliar en caso de manía aguda y en ciertas anómalas de los movimientos	23 ± 5
Clorazepato	Trastornos de ansiedad, trastornos convulsivos	20 ± 0.9



Clordiazepoxido	Trastornos de ansiedad, tratamiento de la abstinencia al alcohol, premedicación anestésica	10 ± 3.4
Diazepam	Trastornos de ansiedad, estado epiléptico, relajación del músculo estriado, medicación preanestésica	43 ± 13
Lorazepam	Trastornos de ansiedad, medicación preanestésica	2-4
Midazolam	Medicación preanestésica y transoperatoria	1.9 ± 0.6
Triazolam	Insomnio	2.9 ± 1

### **Barbitúricos**

Es un grupo de fármacos que produce depresión reversible de todos los tejidos excitables, el sistema nervioso central presenta alta sensibilidad, tanto así, que al ser administradas concentraciones anestésicas, son menores los efectos directos en los tejidos periféricos.

Las dosis no anestésicas suprimen preferentemente las transmisiones polisinápticas, disminuyendo la facilitación e intensificando la inhibición. La interrupción en la transmisión puede ser a nivel postsináptico, como ocurre en la sustancia negra, neuronas talámicas de relevo, núcleo cuneiforme, células corticales y piramidales del cerebelo, o también se puede dar presinápticamente, como ocurre en la médula espinal. Se intensifica la inhibición cuando la neurotransmisión es mediada por el GABA sobre sus receptores del subtipo A.<sup>5,20</sup>

A nivel periférico, los barbitúricos disminuyen la transmisión en los ganglios autónomos y reducen la excitación nicotínica por los colinomiméticos, provocando la disminución de la presión arterial. Si son utilizados en anestesia, aumentan el bloqueo neuromuscular de tubocurarina o decametonio, lo cual puede ser explicado



a su propiedad de inhibir el paso del impulso nervioso a través de los receptores nicotínicos.<sup>20</sup>

Los barbitúricos aumentan la duración del sueño, alterando sus etapas de una manera dependiente de la dosis. Este grupo farmacológico disminuye la latencia del sueño, cantidad de despertares, duración del sueño REM y de ondas lentas.

Durante la administración nocturna repetitiva puede ocurrir tolerancia a los efectos sobre el sueño en unos cuantos días, reduciendo el tiempo total de sueño hasta en un 50% después de dos semanas de utilización. La interrupción abrupta del tratamiento generalmente produce efecto rebote de todos los aspectos que deberían disminuir con los barbitúricos.<sup>5,20</sup>

#### **IV. MATERIALES**

- Vademécum Clínico
- Texto farmacología
- Guías de práctica clínica

#### **V. PROCEDIMIENTO**

- Realizar una lista de los 10 sedantes e hipnóticos más utilizados.
- De los fármacos anteriormente descritos buscar: indicaciones, dosis, mecanismos de acción, vida media y eliminación de cada medicamento.

#### **VI. CUESTIONARIO**

1. ¿Cuáles son las principales reacciones adversas de los sedantes e hipnóticos?
2. Dibuje el mecanismo de acción de las benzodiazepinas
3. ¿Cuál es la diferencia entre el mecanismo de acción de las benzodiazepinas y los barbitúricos?
4. ¿Cómo se trata la intoxicación por benzodiazepinas?



## **PRÁCTICA N° 15**

### **ANTIBIÓTICOS.**

#### **I. INTRODUCCIÓN**

Este grupo de medicamentos se caracterizan por ser de los más utilizados pero también de los que más se abusa y peor se prescribe, entre las inevitables consecuencias de esta mala práctica se encuentra la modificación fenotípica de los microorganismos que produce resistencia a los medicamentos existentes, obligando a la búsqueda de nuevas moléculas con efecto antibiótico. El problema radica en que el descubrimiento de estas nuevas alternativas no es frecuente lo que enlentece la velocidad de producción, por lo que la mejor estrategia para prevenir el fenómeno de las resistencias bacterianas es la prescripción y el uso racional de los fármacos ya existentes, por tal motivo es de vital importancia que los estudiantes del área de la salud, principalmente de medicina, tengan bases claras que permitan dar un manejo racional en la práctica clínica.

#### **II. OBJETIVOS**

- Reconocer la utilidad de los fármacos antibióticos
- Comprender mediante casos clínicos las propiedades y características farmacológicas de los fármacos antibióticos

#### **III. FUNDAMENTO TEÓRICO**

Los antibióticos se pueden clasificar de acuerdo a su estructura química y mecanismo su acción en:



- Inhibidores de la síntesis de la pared celular bacterianas, como  $\beta$ -lactámicos (penicilinas, cefalosporinas y carbapenem) y otros medicamentos como cicloserina, vancomicina y bacitracina
- Que actúan en la membrana celular, aumentando la permeabilidad y favoreciendo la salida de elementos intracelulares, como detergentes del tipo polimixina; antimicóticos de tipo polieno (nistatina y anfotericina) o que se adhieren a los esteroides de la pared celular y el lipopéptido (daptomicina)
- Que alteran la función de las subunidades ribosómicas 30S o 50S para inhibir en forma reversible la síntesis de proteínas (cloranfenicol, tetraciclinas, eritromicina, clindamicina, estreptograminas y linezólid)
- Antimetabolitos como trimetoprim y las sulfonamidas, que bloquean enzimas que participan del metabolismo del folato.
- Que se adhieren a la subunidad ribosómica 30S y alteran la síntesis de proteínas(aminoglucósidos)
- Que modifican el metabolismo del ácido nucleico como las rifamicinas (rifampicina y rifabutina), o que inhiben enzimas como las topoisomerasas (quinolonas).<sup>4,5</sup>

Entre los factores que afectan la efectividad del tratamiento antibiótico se encuentran el tiempo y la concentración en el sitio de infección. Esta concentración debe ser suficiente como para inhibir el crecimiento del patógeno causal, si el sistema inmunitario del hospedador esta en optimas condiciones, basta con un efecto inhibitor propio de los fármacos bacteriostáticos. Pero si este es deficiente, se necesita un antibiótico que destruya el patógeno, en estos casos debe ser utilizado uno con efecto bactericida.

La concentración del fármaco en el sitio de infección no sólo debe inhibir el microorganismo sino también estar por debajo de la concentración que provoca toxicidad en las células humanas.



Los antibióticos se pueden utilizar en tres casos, en profilaxis, terapia empírica, y tratamiento definitivo. Cuando se utilizan como tratamiento empírico o inicial, debe seleccionarse un fármaco que tenga amplio espectro, para que logre abarcar la mayor cantidad de microorganismos patógenos probables, debido a que en esta no se tiene definido el agente causal, también pueden utilizarse combinaciones de varios medicamentos, sin embargo, cuando se identifica patógeno, debe colocarse el tratamiento definitivo con el antibiótico pertinente. Entre los principales errores en la prescripción de antibióticos se encuentran la omisión del agente causal al momento de prescribir un antibiótico de espectro reducido y prescindir de reducir el espectro una vez que se identifica el microorganismo. De acuerdo a esto, la primera consideración al seleccionar un antibiótico es verificar si está indicado.<sup>5,6</sup>

Existen técnicas rápidas de laboratorio para examinar el tejido infectado. El método más valioso y rápido es la tinción de Gram. No obstante, en muchas situaciones, no es posible identificar lo suficiente la morfología del agente causal como para establecer un diagnóstico bacteriológico específico, lo que impide seleccionar un antibiótico de espectro reducido, en particular cuando la infección es grave. En estos casos está indicado administrar un antibiótico de amplio espectro mientras se obtienen los resultados de laboratorio que permitirán identificar al microorganismo. Para establecer el tratamiento definitivo, la antibioticoterapia debe ser cambiada por un antibiótico de espectro más reducido y de mayor especificidad, después que se ha identificado el patógeno y se conoce su sensibilidad.<sup>5</sup>

#### **IV. MATERIALES**

- Vademécum Clínico
- Texto farmacología
- Guías de prácticas clínicas



## V. PROCEDIMIENTO

### Caso 1:

Paciente masculino de 30 años y 86 kg de peso, que ingresa con un cuadro de apendicitis hace más de 24hr cuya cirugía ha sido postergada, por tanto se ha mantenido en ayuno con una vía venosa periférica en la que se ha administrado solución de hartman (1000ml/24h). El día de hoy ha presentado cuadros febriles sostenidos por encima de 38°C, que no se controlan con medidas convencionales, a la exploración lo encuentra pálido, diaforético, con facies francas de dolor, su abdomen se observa con distensión leve, se ausculta sin ruidos peristálticos, y se palpa un abdomen duro con hiperestesia generalizada por lo que es llevado de urgencia a quirófano y posteriormente se le prescribe siguiente tratamiento:

- Sol. Hartman 1000ml IV P/24H
- Cefalotina 1gr IV c/8hr
- Metronidazol 100mg IVc/12h
- Gentamicina 80mg IV c/12h

Del caso anterior:

1. Determine los efectos farmacológicos de cada uno de los elementos incluyendo: indicaciones, contraindicaciones, dosis, mecanismo de acción.
2. Determine y analice las vías de ministración ideales de acuerdo al caso
3. Analice las posibles complicaciones o efectos adversos del tratamiento establecido
4. Analice y determine qué alternativas farmacológicas podrían ser de utilidad

### Caso 2:

Paciente masculino de 34 años de edad, el cual ingreso por un cuadro de neumonía grave, además está con ventilación mecánica invasiva, le notifican que el paciente



puede ser VIH+. Actualmente se encuentra bajo sedación, analgesia y apoyo ventilatorio. Entre los medicamentos indicados encuentra:

Sol. Salina 0.9% 1000ml IV P/24H

- Vancomocina 1g IV c/12h
- Meropenem 1g IV c /8HR
- Fluconazol 100mg IV c/12
- Anfotericina B 42mg IV c/24H, medicar 30 minutos antes con acetaminofen 1gr IV e Hidrocortisona 100mg IV

Del caso anterior:

Determine los efectos farmacológicos de cada uno de los elementos incluyendo: indicaciones, contraindicaciones, dosis, mecanismo de acción.

1. Determine y analice las vías de ministración ideales de acuerdo al caso
2. Analice las posibles complicaciones o efectos adversos del tratamiento establecido
3. Analice y determine qué alternativas farmacológicas podrían ser de utilidad

#### **VI. CUESTIONARIO:**

1. ¿Cuáles son las indicaciones de Vancomicina, meropenem, fluconazol y anfotericina B?
2. Describa el volumen de distribución, % de unión a proteínas plasmáticas, vías de eliminación de los fármacos prescritos
3. ¿Cuáles son las contraindicaciones y precauciones?



## PRÁCTICA No 16 FARMACOVIGILANCIA

### I. INTRODUCCIÓN

La farmacovigilancia es una práctica fundamental para establecer una farmacoterapéutica segura que impulse la eficacia de los programas de salud pública, esta es de gran importancia para prevenir o reducir los efectos adversos de los pacientes y mejorar así la salud pública. Es primordial establecer mecanismos que evalúen y controlen los efectos de los fármacos en las poblaciones excluidas de las fases del desarrollo de un medicamento. Por tal motivo los estudiantes de medicina deben adquirir los conocimientos fundamentales para convertirse en actores activos en farmacovigilancia y contribuir a la seguridad del paciente.

### II. OBJETIVOS

- Conocer el marco conceptual, definiciones y alcances de la Farmacovigilancia o Estudios de Fase IV en farmacología Clínica.
- Conocer la importancia de la Farmacovigilancia en la detección de los riesgos y de los beneficios que pueden producir los medicamentos

### III. FUNDAMENTO TEÓRICO

**Farmacovigilancia:** Es la actividad de la salud pública que comprende la identificación, registro, notificación, análisis, evaluación y control de las reacciones adversas a medicamentos (RAM) y eventos adversos asociados a medicamentos (EAM), fundamentada en la cooperación de los profesionales de la salud para establecer información sobre la causalidad, frecuencia y determinación de los factores de riesgos asociados a la aparición de los mismos en la comunidad, grupos o individuos, la información recolectada permite la realización de análisis riesgo-



beneficio y tomar de decisiones que minimicen el riesgo asociado a la utilización de medicamentos, se realiza de dos formas:

- a) **Farmacovigilancia Activa:** Es aquella en la que el personal sanitario, principalmente el Químico Farmacéutico, se responsabiliza de la detección de RAM y/o EAM, mediante seguimiento farmacoterapéutico e interacción dinámica con el paciente y demás profesionales de la salud.
- b) **Farmacovigilancia Pasiva:** Está fundamentada en la información voluntaria sobre una posible RAM y/o EAM; esta puede provenir de cualquier profesional del área de la salud o del paciente, quienes la registran en un formato diseñado y validado para este fin.

Para la ejecución eficiente de este programa hay que tener en cuenta los siguientes conceptos:

**Evento adverso a medicamentos:** Según el instituto nacional de vigilancia de medicamentos y alimentos INVIMA lo ha definido como: “Cualquier suceso médico desfavorable que puede presentarse durante el tratamiento con un medicamento, pero que no necesariamente tiene una relación causal con este”. Se pueden clasificar en:

- **Serio:** “Evento que condujo a la muerte o al deterioro serio de la salud del paciente, equipo de salud o todo aquel que se vea implicado directa o indirectamente en el uso del medicamento”.
- **No serio:** “Evento que no condujo a la muerte o deterioro serio de la salud del paciente, equipo de salud o todo aquel que se vea implicado directa o indirectamente en el uso del medicamento”<sup>21</sup>

#### IV. MATERIAL

- Guías de práctica clínica
- Fuentes de información institucionales



## V. PROCEDIMIENTO

De cada caso resolver:

- a. ¿Según el algoritmo de naranjo, hay relación causal el fármaco prescrito y la RAM presentada?
- b. ¿El problema presentado tiene relación con la enfermedad, con un efecto idiosincrático o efecto farmacológico del medicamento prescrito?
- c. ¿La RAM presentada es de Tipo A o B?
- d. ¿Existe algún tratamiento para la RAM en cuestión?

### Caso1

Paciente femenino de 26 años, sexo femenino, diagnosticado con síndrome gripal, como presenta rinorrea que estaba recibiendo 50mg de difenhidramina VO cada 6 horas por 2 días, llega a su consulta con taquicardia, náuseas, obnubilación, excitación y disnea.

### Caso 2

Paciente femenino de 9 años diagnosticado con amigdalitis pultácea, por lo que se ha prescrito amoxicilina 750 mg/24h VO por siete días. En el primer día aparece rash cutáneo en tronco y extremidades, prurito intenso con lesiones por escoriación. Por lo que se suspende el tratamiento y se consulta al médico tratante.

**Problema 3:** Paciente masculino de 50 años, diagnosticado con cardiopatía isquémica, por lo que se prescribe 50mg de atenolol por vía oral, después de 1 meses de tratamiento empieza a mostrar temblores e impotencia sexual.



## VI. CUESTIONARIO

1. ¿Qué diferencia existe entre una RAM y un evento adverso?
2. ¿Cuáles son los factores que favorecen la aparición de un RAM?
3. ¿Qué es notificación espontánea?
4. ¿Qué es una RAM grave?
5. ¿Cuál es el formato nacional de reporte de RAM y que información se consigna en este?
6. ¿En qué consiste una RAM Tipo A y una RAM Tipo B?
7. ¿Cuánto tiempo se tiene para notificar una RAM leve y una RAM grave?

## BIBLIOGRAFÍA:

1. Hevia J, Huete A, Alfaro F, Palominos V. Herramientas útiles y métodos de búsqueda bibliográfica en PubMed: guía paso a paso para médicos. 2017;(145):1610-1618.
2. Gómez-Luna E , Fernando-Navas D , Aponte-Mayor G, Betancourt-Buitrago L. Metodología para la revisión bibliográfica y la gestión de información de temas científicos, a través de su estructuración y sistematización. Dyna. 2014;(81):158-163.
3. Goodman L, Bunton L, Hilal-Dandan R, Knollmann B, Gilman A, Gilman A et al. Las bases farmacológicas de la terapéutica. México D.F. [etc.]: McGraw-Hill; 2019.
4. Pezzini, B., Silva, M. and Ferraz, H., 2007. Formas farmacêuticas sólidas orais de liberação prolongada: sistemas monolíticos e multiparticulados. Revista Brasileira de Ciências Farmacêuticas, 43(4).
5. Lorenzo-Velázquez B, Lorenzo Fernández P. Manual de farmacología básica y clínica. Madrid: Editorial Médica Panamericana; 2013. Farmacología básica y clínica (12a. ed.).



6. Trevor A, Katzung B, Masters S, Katzung B. Katzung & Trevor's review of pharmacology. New York: McGraw-Hill Medical; 2008. Sáiz Ruiz, J. and Montes Rodríguez, J., 2003.
7. Molina F, González M, Guerra A, Muñoz F, Mendoza R. Farmacocinética y farmacodinamia de los antibióticos en el paciente críticamente enfermo. Primera parte. Acta Colombiana de Cuidado Intensivo. 2016;16(2):95-101.
8. Kuti j. cómo optimizar la farmacodinamia antimicrobiana: una guía para un programa de optimización del uso de antimicrobianos. revista médica clínica las condes. 2016;27(5):625-635.
9. Peinado Manzano M. Funcionamiento del sistema nervioso autónomo y expectativa del control I-E. Análisis y Modificación de Conducta. 2012;11(28).
10. Escobar C, Barrios V. Prescripción de fármacos antihipertensivos: ¿en el buen camino?. Revista Española de Cardiología. 2015;68(12):1191.
11. Polo García J. Nuevos anticoagulantes frente a anticoagulantes clásicos: ventajas e inconvenientes. SEMERGEN - Medicina de Familia. 2013;39:10-16.
12. Zamora H. M, Nazar J. C, Lema F. G. Nuevos anticoagulantes orales y antiagregantes plaquetarios, en el período perioperatorio de cirugía no cardíaca. Parte 2: Nuevos antiagregantes plaquetarios. Revista Chilena de Anestesia. 2018;47(4):233-239.
13. Garrido Carrasco E. Análogos de Insulina. Anales de la Facultad de Medicina. 2014;62(2):135.
14. de Luis D, Romero E. Análogos de insulina: modificaciones en la estructura, consecuencias moleculares y metabólicas. SEMERGEN - Medicina de Familia. 2013;39(1):34-40.
15. Martínez-Hernández, A., Martina-Luna, M., Rendón-Macías, M., Iglesias-Leboreiro, J., Bernárdez-Zapata, I. and Jiménez-Rivera, N., 2019. Prescripción de antieméticos en urgencias en niños con gastroenteritis aguda. Revista Mexicana de Pediatría, 86(4), pp.147-150.



16. Madrideo Mora, R. and Hernández Corredoira, V., 2005. Antieméticos. FMC - Formación Médica Continuada en Atención Primaria, 12(9), pp.631-640.
17. Sterrantino, C., Duarte, G., Costa, J. and Vaz-Carneiro, A., 2016. Análise da Revisão Cochrane: Antihistamínicos para a Constipação. Cochrane Database Syst Rev. 2015;11:CD009345. Acta Médica Portuguesa, 29(3), p.164.
18. Chérrez-Ojeda, I., Calderón, J., Calero, E., Terán, C. and Chérrez, A., 2018. ¿Son seguros los productos naturales analgésicos en los pacientes con alergia a los antiinflamatorios no esteroideos?. Revista Alergia México, 65(1), p.99.
19. Fármacos sedantes/hipnóticos. Medicine - Programa de Formación Médica Continuada Acreditado, 8(106), pp.5711-5714.
20. Domínguez de Pablos, G. and Sánchez Lechuga, E., 2009. Ansiolíticos e hipnóticos en la insuficiencia respiratoria y cardíaca. FMC - Formación Médica Continuada en Atención Primaria, 16(4), pp.232-241.
21. ROLDÁN J. Farmacovigilancia: datos sobre el estado actual de esta disciplina en Chile. Revista médica clínica CONDE. 2016;27(5):585-593.
22. Fernández, C., 2014. Memorias del curso farmacovigilancia básica para farmacéuticos. Revista Clínica Escuela de Medicina UCR-HSJD, 4(2).
- aldiano, I. and Zavaglia, C., 2015. A definição terminológica em um glossário da Farmacovigilância: algumas considerações. Revista GTLex, 1(1), pp.91-109.



CORPORACIÓN UNIVERSITARIA  
**RAFAEL NÚÑEZ**  
PARA QUE TU DESARROLLO CONTINÚE SU MARCHA

**Campus Cartagena**  
Centro Comercial Pasaje de la Moneda  
Cra. 8B #8-56  
Tel. 6517088 Ext 1202

**Campus Barranquilla**  
Cra 54 #66-54  
Tel. (5) 3602197 Ext 1319

[www.curn.edu.co](http://www.curn.edu.co)

Institución Universitaria | Vigilada Mineducación  
Reconocimiento personería jurídica: Resolución 6644 del 5 de junio de 1985 Mineducación.

