



**Universidad del Sureste  
Escuela de Medicina**

“Hipoglucemiantes”

Materia:

Fisiopatología III.

Docente:

Dr. Marco Polo Rodríguez Alfonzo

Alumna:

Michelle Junuem Maldonado Hernández

Semestre:

4°B

# FÁRMACOS SECRETAGOGOS:

- Sulfonilureas.
- Meglitinidas.

# Sulfonilureas

Mecanismo de acción	Clasificación	Efectos adversos
<p>Se unen a unos receptores específicos (SUR-1) asociados a los canales de K sensibles a ATP de las células B del páncreas, lo que provoca el cierre de dichos canales. Como consecuencia se produce una despolarización, que facilita la entrada de calcio y de este modo se estimula la secreción de insulina.</p>	<p><input type="checkbox"/> <b>Sulfonilureas de primera generación:</b> Tolbutamida, Clorpropamida, Tolazamida, Acetohexamida.</p> <p><input type="checkbox"/> <b>Sulfonilureas de segunda generación:</b> Glibenclamida, Gliburida, Glipizida.</p> <p><input type="checkbox"/> <b>Sulfonilureas de tercera generación:</b> Glimepirida, Gliquidona, Glisentida, Glicazida.</p>	<p><input type="checkbox"/> Por eso la hipoglucemia, que puede ser intensa y prolongada. El riesgo es mayor si se retrasa una comida, por eso es importante comer.</p> <p><input type="checkbox"/> Después de ejercicio extenuante o si se consume alcohol.</p> <p><input type="checkbox"/> Incremento de peso</p> <p><input type="checkbox"/> Molestias gastrointestinales ligeras</p> <p><input type="checkbox"/> Hipersensibilidad</p>

<b>Generación</b>	<b>Fármaco</b>	<b>Presentación</b>	<b>Administración</b>	<b>Dosis</b>
<b>Primera</b>	<b>Tolbutamida</b>	Tabletas de 250 y 500 mg, algunas presentaciones tienen 1 g.	Se administra por vía oral y es absorbida en el tracto gastrointestinal. Su tiempo de acción dura de 6 a 10 horas.	1 500 a 3 000 mg por día, fraccionada en tres tomas, 15 minutos antes de cada alimento
<b>Segunda</b>	<b>Glibenclamida</b>	Se presenta en tabletas de 2.5 mg en combinación con biguanidas o tabletas de 5 mg sola.	Prescrita para administrarse por vía oral. Se absorbe con rapidez en el tubo digestivo.	15 a 30 mg diarios, fraccionada en tres tomas.
<b>Tercera</b>	<b>Glimepirida,</b>	Se presenta en tabletas de 1, 2, 3 y 4 mg.	Es de administración oral y se absorbe en el tubo digestivo. Se utiliza cuando la concentración de glucosa en sangre no puede controlarse en forma adecuada sólo con dieta, ejercicio físico y disminución de peso.	Dosis usual en pacientes con diabetes bien controlada es de 1 a 4 mg diarios

# Meglitinidas

Mecanismo de acción	Clasificación	Indicaciones	Efectos adversos
<p>Son derivados de la meglitinida, porción no sulfonílica de la glibenclamida. Se unen al receptor SUR-1, a un lugar de unión distinto al de las sulfonilureas, induciendo por lo tanto la liberación de insulina. Sólo ejercen este efecto en presencia de glucosa. Por ello, su efecto sobre la secreción de insulina se ajusta de forma más precisa a los valores de hiperglucemia posprandial.</p>	<p><input type="checkbox"/> <b>Repaglinida.</b> <b>Dosis recomendada:</b> 0.5 a 4 mg con cada alimento, y la dosis máxima al día es de 16 mg. Se presenta en tabletas de 0.5, 1 y 2 mg.</p> <p><input type="checkbox"/> <b>Nateglinida.</b> <b>Dosis:</b> 120 mg con cada alimento, y la dosis máxima al día es de 720 mg. Disponible en tabletas de 120 mg</p>	<p>Se utilizan en pacientes con hiperglucemia posprandial. Especialmente en ancianos y en personas con insuficiencia renal.</p> <p>La nateglinida únicamente se utiliza en asociación con metformina, mientras que la repaglinida puede usarse en monoterapia o combinada con metformina .</p>	<p><input type="checkbox"/> Incremento de peso es similar al de las sulfonilureas.</p> <p><input type="checkbox"/> Efecto dependiente de la presencia de glucosa por lo que determina que el riesgo de hipoglucemia en ayunas sea menor.</p> <p><input type="checkbox"/> Molestias gastrointestinales.</p>

# FÁRMACOS SENSIBILIZADORES:

- Biguanidas.
- Tiazolidinedionas o glitazonas.

# Biguanidas

## METFORMINA

Mecanismo de acción	Posología	Indicaciones	Efectos adversos
<p>Aumento de la actividad de AMPK que puede ser por un efecto agonista directo sobre la AMPK o por supresión de la oxidación mitocondrial hepática, resultando en una más alta relación AMP/ ATP y así un activación secundaria de AMPK. Tiene un aparente efecto de sensibilización de la insulina sobre la captación de glucosa en el musculo. Disminuye la producción de glucosa hepática.</p>	<ul style="list-style-type: none"><li>❑ Dosis es de 1 000 a 2 000 mg diarios fraccionada en tres tomas.</li><li>❑ El medicamento se presenta en tabletas de 500 y 850 mg.</li></ul>	<p>Es prescrita en forma conjunta a la dieta, en obesos con diabetes mellitus tipo 2.</p> <p>Se administra por vía oral y es absorbida en el tubo digestivo. Su vida media es de 2 a 3 horas.</p>	<ul style="list-style-type: none"><li>❑ Produce irritación del tubo digestivo.</li><li>❑ Dolor en epigastrio.</li><li>❑ Náuseas.</li><li>❑ Vómito</li><li>❑ Diarrea.</li><li>❑ La acidosis láctica es una posibilidad muy rara con el uso de metformina.</li></ul>

# Tiazolidinedionas o glitazonas.

Mecanismo de acción	Clasificación	Indicaciones	Efectos adversos
<p>Químicamente son ligandos del receptor gamma activador de la proliferación del peroxisoma y (PPAR,γ) grupo de receptores hormonales nucleares que participan en la regulación de genes relacionados al metabolismo de la glucosa y los lípidos, después de activarse el PPAR,γ y tener una compleja acción en los lipocitos, producen un aumento de la sensibilidad de los tejidos a la insulina.</p> <p><b>Normalizan la glucosa plasmática por los siguientes mecanismos:</b></p> <ul style="list-style-type: none"><li>❑ Sensibilizan los tejidos periféricos a la acción de la insulina.</li><li>❑ Disminuyen la producción hepática de glucosa.</li><li>❑ Ocasionan mayor expresión del transportador de glucosa (GLUT1 y GLUT2) y aumentan la captación de la misma.</li><li>❑ Disminuyen principalmente las glucemias de ayunas y la HbA1c y en menor medida las glucemias posprandiales, no producen hipoglucemias.</li></ul>	<ul style="list-style-type: none"><li>❑ <b>Pioglitazona :</b> Se presenta en comprimidos de 15 y 30 mg. La dosis usual es de 15 a 30 mg al día, la dosis máxima es de 45 mg al día.</li><li>❑ <b>Rosiglitazona:</b> Se presenta en comprimidos de 4 y 8 mg. Se recomienda iniciar con 4 mg una vez al día e incrementar a 8 mg si es necesario en 1 a 2 tomas al día con o sin alimentos.</li></ul>	<p>Pacientes con diabetes mellitus tipo 2 obesos insulinoresistentes, a quienes les será imposible normalizarse con medidas no farmacológicas e incluso para aquellos que presentan intolerancia digestiva a la metformina.</p>	<ul style="list-style-type: none"><li>❑ La principal reacción a tomar en cuenta es el daño hepático.</li><li>❑ La ganancia de peso es muy rara, sólo</li></ul>

# **INHIBIDORES DE LA ABSORCIÓN DE MONOSACÁRIDOS:**

- Inhibidores de alfa-glucosidasas.**

# Inhibidores de alfa-glucosidasas.

Mecanismo de acción	Ejemplo de Fármaco	Vía de administración e Indicaciones	Efectos adversos
<ul style="list-style-type: none"><li>❑ Las <math>\alpha</math>-glucosidasas son enzimas presentes en las microvellosidades intestinales que se encargan de la degradación de los oligosacáridos de la dieta, a los que convierten en monosacáridos, permitiendo así su absorción.</li><li>❑ La inhibición de estas enzimas retrasa la absorción de los hidratos de carbono complejos procedentes de la dieta.</li><li>❑ Al ser éstos la principal fuente de glucosa exógena, los inhibidores de las <math>\alpha</math>-glucosidasas consiguen reducir la hiperglucemia posprandial.</li></ul>	<ul style="list-style-type: none"><li>❑ Acarbosa:</li><li>❑ Dosis: inicial de 50 mg dos veces al día con incremento gradual hasta 100 mg tres veces al día. Debe administrarse con el primer bocado de alimento ingerido.</li><li>❑ El fármaco se presenta en tabletas de 50 y 100 mg.</li></ul>	<p>Se administra por vía oral y es absorbida en el tubo digestivo.</p> <p>Indicada en aquellos con diabetes mellitus tipo 2 como terapia primaria; principalmente en combinación con hipoglucemiantes orales e insulina.</p>	<p>El principal efecto es la flatulencia y distensión abdominal en 30 a 75% de los casos, de forma ocasional diarrea y menos frecuente dolor abdominal debido a que los disacáridos no degradados permanecen en la luz del intestino y retienen líquido osmóticamente.</p>

# FÁRMACOS QUE MIMETIZAN LAS INCRETINAS

- ❑ Análogos del péptido análogo del glucagón tipo 1.
- ❑ Inhibidores de la enzima dipeptidil-peptidasa 4 .

# Análogos del péptido análogo del glucagón Tipo 1

Mecanismo de acción	Ejemplo de Fármaco	Vía de administración e Indicaciones	Efectos adversos
<p>Son agonistas del receptor del GLP-1 situado en las células ~ pancreáticas.</p> <ul style="list-style-type: none"><li>❑ Incremento de la secreción de insulina dependiente de glucosa y reducción de la secreción de glucagón, lo que comporta una reducción de la glucemia y de los niveles de HbA1c.</li><li>❑ Reducen el apetito e inhiben la ingesta al provocar sensación de saciedad, con lo que disminuye la ingesta calórica y se produce una reducción del peso corporal.</li></ul>	<p>❑ <b>Exenatida:</b></p> <p>Dosis inicial es de 5 mcg dos veces al día, una hora antes del desayuno y la cena.</p> <p>Presentación: El fármaco se encuentra disponible en jeringa prellenada de 5 o 10 mcg.</p>	<p>Se aplica en inyección subcutánea en el abdomen, muslo o brazo, por lo general antes de los alimentos. Se absorbe con rapidez y alcanza sus concentraciones plasmáticas después de 2 horas.</p>	<ul style="list-style-type: none"><li>❑ Náuseas.</li><li>❑ Vómito.</li><li>❑ Diarrea.</li><li>❑ Mareos.</li><li>❑ Cefalea.</li><li>❑ Irritación gástrica.</li><li>❑ Nerviosismo.</li></ul>

# Inhibidores de la enzima dipeptidil-peptidasa 4

Mecanismo de acción	Ejemplo de Fármaco	Vía de administración e Indicaciones	Efectos adversos
<ul style="list-style-type: none"><li>❑ Son fármacos que inhiben la DPP -4, de forma que incrementan la semivida y la duración de acción de las incretinas endógenas, potenciando así sus efectos.</li><li>❑ Ligeramente menos efectivos que los análogos del receptor GLP-1 y no reducen el peso corporal, debido a que las concentraciones fisiológicas de incretinas que se consiguen son inferiores a los niveles suprafisiológicos de los análogos del GLP-1.</li><li>❑ La inhibición de la DPP-4 altera los niveles de otros péptidos que pueden modular el perfil beneficio-riesgo de estos fármacos.</li><li>❑ Se incrementan los niveles de neuropéptido Y (NPY), lo que contrarresta en parte la reducción de peso promovida por el GLP-1.</li></ul>	<p><b>Vildagliptina:</b></p> <p>dosis usual es de 50 mg 1 a 2 veces al día. Se presenta en tabletas de 50 mg y suele estar acompañada por una biguanida.</p>	<p>Se administra por vía oral y se absorbe en el intestino delgado.</p>	<ul style="list-style-type: none"><li>❑ Mareo</li><li>❑ Cefalea</li></ul>

# BIBLIOGRAFÍA.

- ❑ Aristil Chéry, p (Ed.). (2013). Fármacos diuréticos. En Manual de farmacología básica y clínica (6ta edición ed., pp. 95-101). Puebla, México: Mc Graw Hill.González,
- ❑ Goodman & Gilman: LAS BASES FARMACOLÓGICAS DE LA TERAPÉUTICA, Mac Graw Hill. 13º edición. 2017.
- ❑ Velázquez, I. (2018). Velázquez farmacología básica y clínica (19Th ed., cap. 18 Ansiolíticos, pag. 299-309). Madrid, Españ