

# Mapa Conceptual

## Farmacología

Alumno; Jaime Enrique Prats Gómez

[Jimmyprats25@gmail.com](mailto:Jimmyprats25@gmail.com)

MODALIDAD SEMI-ESCOLARIZADO

Carrera: Licenciatura en Enfermería

Asesor Académico  
Dra. Claudia Guadalupe  
Figueroa López



Universidad del Sureste,  
Campus Pichucalco, Chiapas



«Fármacos Usados en el Tratamiento  
de Enfermedades  
GASTROINTESTINALES»

3er.  
Cuatrimestre

# Desarrollo

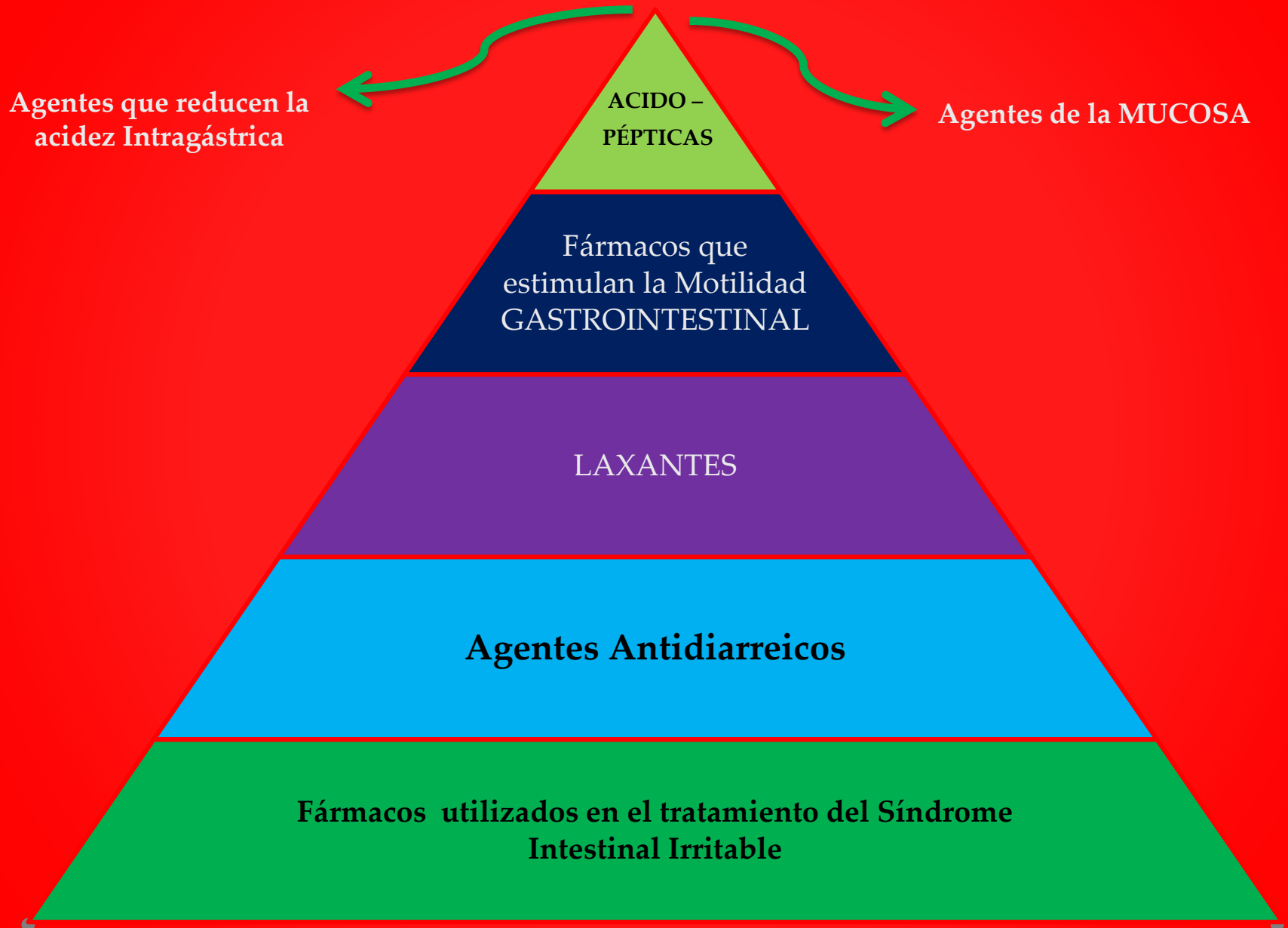
Se le conoce como enfermedades gastrointestinales; todos aquellos que atacan el estómago y los intestinos, generalmente son ocasionadas por bacterias, parásitos, virus y algunos alimentos como leche y grasas, aunque también existen algunos medicamentos que las provocan. Dentro de los síntomas de dichas enfermedades está la diarrea y por consiguiente la deshidratación.

Un grupo de medicamentos utilizados para tratar enfermedades gastrointestinales podrían estar implicados en la reducción de la capacidad para **absorber calcio** y **generar así problemas** de debilidad de huesos.

Estos medicamentos, conocidos como "**inhibidores de la bomba de protones**" (como el común Omeoprazol), sirven para regular los niveles de acidez en el jugo gástrico, por lo que se utilizan en el tratamiento de enfermedades gastrointestinales y úlceras pépticas.

Éste se encarga de codificar una subunidad de la bomba de protones que es imprescindible para que se produzca una correcta resorción del calcio en las células óseas, proceso llevado a cabo por los osteoclastos. En un subgrupo de los pacientes que sufren osteopetrosis se han dado muestras de una **enfermedad de signo contrario**: el raquitismo óseo debido a los bajos niveles de calcio.

# Fármacos Usados en el Tratamiento de Enfermedades GASTROINTESTINALES



# Fármacos Utilizados en Enfermedades ACIDO - PÉPTICAS

Las enfermedades ácido-pépticas incluyen reflujo gastroesofágico, úlcera péptica (gástrica y duodenal), y lesión de la mucosa relacionada con el estrés.

## Agentes que reducen la Acidez Intragástrica

### Fisiología de la Secreción Ácida

La célula parietal contiene receptores para gastrina, histamina (H2) y acetilcolina (muscarínico, M3) Cuando la acetilcolina (de los nervios posganglionares vágales) y la gastrina (liberada en la sangre desde las células G antrales) se unen a los receptores celulares parietales, causan un aumento en el calcio citosólico.

### ❖ Química y Farmacocinética;

Cuatro antagonistas H2 se encuentran en uso clínico: la cimetidina, la ranitidina, la famotidina y la nizatidina. Los antagonistas H2 se eliminan mediante una combinación de metabolismo hepático, filtración glomerular y secreción tubular renal. En los ancianos hay una disminución de hasta 50% en la eliminación del fármaco, así como una reducción significativa en el volumen de distribución.

### ❖ Farmacodinámica;

Los antagonistas H2 reducen la secreción ácida estimulada por la histamina, así como por la gastrina y los agentes colinomiméticos, a través de dos mecanismos, Los antagonistas H2 son especialmente efectivos para inhibir la secreción ácida nocturna (que depende en gran medida de la histamina).

### ❖ Usos Clínicos;

1. *Enfermedad por reflujo gastroesofágico*
2. *Enfermedad por úlcera péptica*
3. *Dispepsia no ulcerosa*
4. *Prevención del sangrado por gastritis relacionada con el estrés*

### ❖ Efectos Adversos;

Los efectos adversos ocurren en menos de 3% de los pacientes e incluyen diarrea, dolor de cabeza, fatiga, mialgias y estreñimiento, Pueden ocurrir cambios en el estado mental (confusión, alucinaciones, agitación).

### ❖ Interacciones con otros medicamentos;

Los fármacos metabolizados por estas vías pueden prolongarse. La ranitidina se une 4-10 veces menos ávidamente que la cimetidina al citocromo P450, todos estos agentes, excepto famotidina, inhiben el metabolismo gástrico de primer paso del etanol, especialmente en las mujeres.

### Antiácidos

Los antiácidos son bases débiles que reaccionan con el ácido clorhídrico gástrico para formar una sal y agua. Su principal mecanismo de acción es la reducción de la acidez intragástrica. La absorción de cloruro sódico puede exacerbar la retención de líquidos en pacientes con insuficiencia cardíaca, hipertensión e insuficiencia renal.

### Antagonistas de los Receptores H2

Fueron los medicamentos recetados con mayor frecuencia en el mundo Con el reconocimiento del papel del *H. pylori* en la enfermedad ulcerosa (que puede tratarse con una terapia antibacteriana apropiada)

## ❑ **Química y Farmacocinética;**

Seis PPI están disponibles para uso clínico: **omeprazol, esomeprazol, lansoprazol, dexlansoprazol, rabeprazol y pantoprazol**, se administran como profármacos inactivos, para proteger el profármaco lábil a los ácidos de la destrucción rápida dentro del lumen gástrico, los productos orales se formulan para su liberación retardada como cápsulas o tabletas con recubrimiento entérico resistentes a los ácidos. Los PPI son bases débiles lipófilas (pKa 4-5), y después de la absorción intestinal se difunden fácilmente a través de las membranas lipídicas en compartimentos acidificados. La reducción de la dosis no es necesaria para pacientes con insuficiencia renal o enfermedad hepática de leve a moderada, pero se debe considerar en pacientes con insuficiencia hepática grave. Debido a que el promedio de vida de una inyección única de la formulación intravenosa es corta, la secreción ácida regresa varias horas más tarde a medida que las bombas se mueven desde las tubulovesículas a la superficie canalicular.

## ❑ **Farmacodinámica;**

A diferencia de los antagonistas de H<sub>2</sub>, los PPI inhiben la secreción ácida tanto en ayunas como estimulada por la comida, porque bloquean la vía común final de secreción de ácido, la bomba de protones. Cuando se administran en dosis equivalentes, los diferentes agentes muestran poca diferencia en la eficacia clínica.

## ❑ **Usos Clínicos;**

1. *Enfermedad por reflujo gastroesofágico*
2. *Enfermedad por úlcera péptica; (Úlceras asociadas a H. pylori, Úlceras asociadas con NSAID, Prevención de resangrado por úlceras pépticas).*
3. *Dispepsia no ulcerosa*
4. *Prevención del sangrado de la mucosa relacionado con el estrés*
5. *Gastrinoma y otras condiciones hipersecretoras*

## ❑ **Efectos Adversos;**

- **Generales:** Al igual que con la mayoría de los medicamentos, los PPI deben prescribirse en la dosis efectiva más baja y sopesar cuidadosamente los riesgos contra los beneficios de su uso a largo plazo.
- **Nutrición;** El ácido también promueve la absorción de minerales unidos a los alimentos (hierro no hemo, sales de calcio insolubles, magnesio). Los metaanálisis de cohortes, y los estudios de casos y controles, han detectado un aumento modesto en el riesgo de fractura de cadera en pacientes que toman PPI a largo plazo.
- **Infecciones respiratorias y entéricas;** Se detectan aumentos en las concentraciones bacterianas gástricas en pacientes que toman PPI, lo cual reviste un significado clínico desconocido.
- **Problemas potenciales debido al aumento de los niveles séricos de gastrina;** El aumento de los niveles de gastrina sérica estimula la hiperplasia de las células ECL y parietales, lo que puede causar hipersecreción ácida de rebote transitoria, con dispepsia o ardor de estómago, después de la interrupción del fármaco, que disminuye dentro de 2-4 semanas después de que la gastrina y la secreción.

## **Inhibidores de la Bomba de Protones (PPI)**

Estos eficaces agentes inhibidores de ácido han asumido el rol principal para el tratamiento de los trastornos ácido-pépticos. Los PPI se encuentran actualmente entre las drogas más recetadas en todo el mundo.

- **Otros problemas potenciales debido a la disminución de la acidez gástrica:** Se han planteado preocupaciones sobre el aumento de la inflamación gástrica y su incidencia en la aceleración de la atrofia de la glándula gástrica (gastritis atrófica) y la metaplasia intestinal, factores de riesgo conocidos para el adenocarcinoma gástrico.

## ❑ **Interacciones con otros medicamentos**

Se han planteado preocupaciones sobre el aumento de la inflamación gástrica y su incidencia en la aceleración de la atrofia de la glándula gástrica (gastritis atrófica) y la metaplasia intestinal, factores de riesgo conocidos para el adenocarcinoma gástrico..

## Agentes de la MUCOSA

Tanto el moco como las uniones epiteliales de célula a célula restringen la difusión de ácido y pepsina. La secreción de bicarbonato epitelial establece un gradiente de pH dentro de la capa mucosa en la que el pH oscila entre 7 en la superficie de la mucosa y 1-2 en el lumen gástrico.

### Sucralfato

#### ● Química y Farmacocinética;

En agua o soluciones ácidas forma una pasta viscosa y tenaz que se une selectivamente a úlceras o erosiones hasta por 6 horas. Menos de 3% de la droga intacta y el aluminio se absorben del tracto intestinal; el resto se excreta en las heces.

#### ● Farmacodinámica;

Se cree que el sulfato de sacarosa con carga negativa se une a las proteínas con carga positiva en la base de las úlceras o de la erosión, formando una barrera física que restringe el daño cáustico adicional y estimula la secreción de prostaglandina y bicarbonato en la mucosa.

#### ● Usos Clínicos;

El sucralfato se administra en una dosis de 1 g cuatro veces al día con el estómago vacío (al menos 1 hora antes de las comidas), administrado como suspensión a través de una sonda nasogástrica) reduce la incidencia de sangrado gastrointestinal superior clínicamente significativa en pacientes críticamente enfermos, hospitalizados en la unidad de cuidados intensivos.

#### ● Efectos Adversos;

Debido a que no se absorbe, el sucralfato está virtualmente desprovisto de efectos adversos sistémicos. Se presenta estreñimiento en 2% de los pacientes a causa de la sal de aluminio.

#### ● Interacciones con otros medicamentos;

El sucralfato se puede unir a otros medicamentos, lo que afecta su absorción.

### Análogos de la Prostaglandina

#### ■ Química y Farmacocinética;

En agua o soluciones ácidas forma una pasta viscosa y tenaz que se une selectivamente a úlceras o erosiones hasta por 6 horas. Menos de 3% de la droga intacta y el aluminio se absorben del tracto intestinal; el resto se excreta en las heces.

#### ■ Química y Farmacocinética;

Existen dos compuestos de bismuto disponibles: **subsalicilato de bismuto**, una formulación sin receta que contiene bismuto y salicilato, y **subcitrato de bismuto potasio**

#### ■ Farmacodinámica;

El subsalicilato de bismuto reduce la frecuencia y liquidez de las deposiciones en la diarrea infecciosa aguda, debido a la inhibición por el salicilato de la prostaglandina intestinal y la secreción de cloruro.

#### ■ Usos Clínicos;

Los compuestos de bismuto se usan en regímenes de cuatro medicamentos para la erradicación de la infección, un régimen consiste en un PPI dos veces al día, combinado con subsalicilato de bismuto (dos tabletas, de 262 mg cada una).

#### ■ Efectos adversos;

El uso prolongado de algunos compuestos de bismuto puede raramente conducir a la intoxicación con este elemento químico, lo que resulta en encefalopatía (ataxia, dolores de cabeza, confusión, convulsiones).

### Compuestos de Bismuto

# Fármacos que estimulan la Motilidad Gastrointestinal

Los agentes que aumentan las presiones del esfínter esofágico inferior pueden ser útiles para la GERD, mejoran el vaciamiento gástrico sirven para la gastroparesia y la demora en el consumo gástrico posquirúrgico, los agentes que estimulan el intestino delgado pueden mostrar beneficios para el íleo postoperatorio o la pseudoobstrucción intestinal Crónica, finalmente, los agentes que mejoran el tránsito colónico son importantes en el tratamiento del estreñimiento

## Fisiología del Sistema Nervioso Entérico

Está compuesto por redes interconectadas de células ganglionares y fibras nerviosas, localizadas principalmente en la submucosa, y entre las capas musculares circular y longitudinal, aunque los nervios simpático y parasimpático extrínsecos se proyectan hacia los plexos submucoso y mientérico, el sistema nervioso entérico puede regular independientemente la motilidad y la secreción gastrointestinal, los receptores 5-HT<sub>4</sub> en las terminales presinápticas de los IPAN parecen mejorar la liberación de CGRP o de acetilcolina, la motilina puede estimular las neuronas excitadoras o las células musculares directamente. La dopamina actúa como un neurotransmisor inhibitorio en el tracto gastrointestinal, disminuyendo la intensidad de las contracciones gástricas y esofágicas.

## Agentes Colinómicos

El betanecol, estimulan los receptores M<sub>3</sub> muscarínicos en las células musculares y en las sinapsis del plexo mientérico.  
El betanecol se usó en el pasado para el tratamiento de la GERD y la gastroparesia.  
La neostigmina inhibidora de la acetilcolinesterasa puede mejorar el vaciamiento gástrico, del intestino delgado y del colon.  
La administración de 2 mg trae como resultado una rápida evacuación colónica de flatos y heces en la mayoría de los pacientes. Los efectos colinérgicos incluyen salivación excesiva, náuseas, vómitos, diarrea y bradicardia.

## Metoclopramina y Domperidona

Son antagonistas del receptor D<sub>2</sub> de la dopamina. Dentro del tracto gastrointestinal, la activación de los receptores de dopamina inhibe la estimulación del músculo liso Colinérgico  
**Usos Clínicos;**  
*Enfermedad por reflujo gastroesofágico, Vaciamiento gástrico alterado, Dispepsia no ulcerosa, Prevención de vómitos, Estimulación posparto de la lactancia*  
**Efectos adversos;**  
Inquietud, somnolencia, insomnio, ansiedad y agitación ocurren en 10-20% de los pacientes, especialmente ancianos, distonías, acatisia, características parkinsonianas, la discinesia tardía, a veces irreversible, se ha desarrollado en individuos tratados durante un periodo prolongado con metoclopramida.

## Macrólidos

Estimulan directamente a los receptores de motilina en el músculo liso gastrointestinal y promueven la aparición de un complejo motor migratorio, intravenosa (3 mg/kg) es beneficiosa en algunos pacientes con gastroparesia, se puede usar en pacientes con hemorragia gastrointestinal superior aguda para promover el vaciamiento gástrico de la sangre antes de la endoscopia.

# Laxantes

Para la mayoría de las personas, el estreñimiento intermitente se puede prevenir mejor con una dieta alta en fibra, una ingestión adecuada de líquidos, ejercicio regular y atender al llamado de las necesidades naturales. Los laxantes se pueden clasificar por su mecanismo de acción principal, pero muchos trabajan a través de más de un mecanismo.

## Laxantes Formadores de Masa

Son coloides hidrófilos que absorben agua y forman un gel voluminoso y emoliente que distiende el colon y promueve el peristaltismo. Las preparaciones comunes incluyen productos vegetales naturales y fibras sintéticas.

## Agentes Lubricantes de las heces (Suavizadores)

Se pueden administrar por vía oral o Rectal (**supositorios de glicerina**), el **aceite mineral** es transparente y viscoso pues lubrica la materia fecal y retarda la absorción de agua de las heces la aspiración puede resultar en una neumonitis lipídica severa.

## Agentes Osmóticos

El colon no puede concentrar ni diluir el fluido fecal: el agua fecal es isotónica en todo el colon. Los laxantes osmóticos son compuestos solubles, pero no absorbibles, que dan como resultado un aumento en la fluidez de las heces debido a un aumento obligado en el líquido fecal.

## Azúcares o Sales no absorbibles;

El **hidróxido de magnesio (leche de magnesia)** es un laxante osmótico de uso común. No debe usarse durante periodos prolongados en pacientes con insuficiencia renal debido al riesgo de hipermagnesemia. El **sorbitol** y la **lactulosa** son azúcares no absorbibles que se pueden usar para prevenir o tratar el estreñimiento crónico. Las dosis altas de agentes osmóticamente activos producen una rápida evacuación intestinal (purgación) en 1-3 horas, el **fosfato de sodio** también está disponible, por prescripción, como formulación de tableta, pero se utiliza con poca frecuencia debido al riesgo de hiperfosfatemia, hipocalcemia, hipernatremia e hipocaliemia.

## Polietilenglicol equilibrado;

Se usan comúnmente para la limpieza colónica completa antes de los procedimientos endoscópicos gastrointestinales. Estas soluciones equilibradas e isotónicas contienen un azúcar osmóticamente activo (PEG), inerte, no absorbible, con sulfato de sodio, cloruro de sodio, bicarbonato de sodio y cloruro de potasio.



## Laxantes Estimulantes

Inducen movimientos intestinales a través de varios mecanismos poco conocidos. Éstos incluyen estimulación directa del sistema nervioso entérico así como electrolitos colónicos y secreción de fluidos.



## Activadores de la secreción de cloruro

**Lubiprostona** es un derivado del ácido prostanoico cuyo uso está autorizado para el estreñimiento crónico y para el síndrome del intestino Irritable. **Linaclotida** y **plecanatida** son péptidos de aminoácidos cortos que se absorben mínimamente y que estimulan la secreción de cloruro intestinal a través de un mecanismo diferente.



## Antagonistas del receptor de Opioides

El uso de opioides después de una cirugía para el tratamiento del dolor, así como de los opioides endógenos, también puede prolongar la duración del íleo posoperatorio, la metilnaltrexona está aprobada para el tratamiento del estreñimiento inducido por opioides en pacientes que reciben cuidados paliativos para enfermedades avanzadas que han tenido una respuesta inadecuada.



## Agonistas del receptor de Serotonina 5-HT4

**Tegaserod** es un agonista parcial de la serotonina 5-HT4, que tiene una alta afinidad por los receptores 5-HT4, pero sin una unión apreciable a los receptores 5-HT3 o a la dopamina.

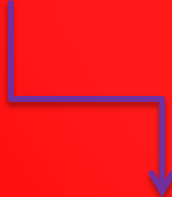
## Derivados de la Antraquinona;

El **áloe**, la **senna** y la **cáscara** se producen naturalmente en las plantas. Estos laxantes son poco absorbidos y después de la hidrólisis en el colon producen una evacuación intestinal entre 6-12 horas cuando se administran por vía oral, y al cabo de las 2 horas cuando se administran por vía rectal.



## Derivados de Difenilmetano;

**Bisacodilo** está disponible en tabletas y supositorios para el tratamiento del estreñimiento agudo y crónico. Este fármaco induce un movimiento intestinal dentro de las 6-10 horas cuando se administra por vía oral, y dentro de 30-60 minutos cuando se aplica por vía rectal.



# Agentes Antidiarreicos;

Se pueden usar de forma segura en pacientes con diarrea aguda de leve a moderada, Los antidiarreicos también se usan para controlar la diarrea crónica causada por condiciones tales como IBS o enfermedad inflamatoria intestinal (IBD).



## Agonistas Opioides

**Loperamida** es un agonista opioide de venta libre que no cruza la barrera ematoencefálica y no tiene propiedades analgésicas, hipotencial adictivo, El **ifenoxilato** es un agonista opioide por prescripción, que no tiene propiedades analgésicas en tomas estándar; sin embargo, las dosis más altas tienen efectos sobre el sistema nervioso central, y su uso prolongado puede conducir a dependencia de opioides.



## Compuestos Coloidales de Bismuto

### ❖ Usos Clínicos;

1. *Inhibición de los efectos de tumores endocrinos;*
2. El octreótido;
3. Tratamiento de los tumores hipofisarios.

### ❖ Efectos adversos;

Las alteraciones en la motilidad gastrointestinal causan náuseas, dolor abdominal, flatulencia y diarrea, debido a que el octreótido altera el equilibrio entre la insulina, el glucagón y la hormona del crecimiento, puede producirse hiperglucemia o, con menor frecuencia, hipoglucemia



## Resinas de unión a sales biliares

La enfermedad del íleon terminal, o la resección quirúrgica, provocan malabsorción de sales biliares, lo que puede causar diarrea secretoria del colon. La **colestiramina**, el **colestipol** o el **colesevelam**, resinas que se unen a sales biliares, pueden disminuir la diarrea causada por el exceso de ácidos biliares fecales, los efectos adversos incluyen hinchazón, flatulencia, estreñimiento e impactación fecal.



## Octreótido

La somatostatina es un péptido regulador clave que tiene muchos efectos fisiológicos;

- Inhibe la secreción de numerosas hormonas,
- Reduce la secreción de líquido intestinal,
- Reduce la motilidad gastrointestinal,
- Reduce el flujo sanguíneo portal y esplácnico,
- Inhibe la secreción de algunas hormonas.

# Fármacos utilizados en el tratamiento del síndrome Intestinal Irritante;

Las terapias farmacológicas para el IBS están dirigidas a aliviar el dolor abdominal y las molestias, así como a mejorar la función intestinal., el IBS es un trastorno idiopático crónico y recurrente, caracterizado por molestias abdominales (dolor, hinchazón, distensión o calambres), Para el dolor abdominal crónico, las dosis bajas de antidepresivos Tricíclicos, Con estas dosis, dichos agentes no tienen efecto sobre el estado de ánimo, pero pueden alterar el procesamiento central de la información aferente visceral.

## Antiespasmódicos (Anticolinérgicos)

No se ha encontrado que el espasmo del intestino delgado o grueso sea una causa importante de síntomas en pacientes con IBS. Los antiespasmódicos funcionan principalmente a través de acciones anticolinérgicas, esta clase incluyen **diciclomina** e **hiosciamina**.

## Antagonistas de los receptores de Serotonina 5-HT<sub>3</sub>

**Farmacocinetica y Farmacodinamica;**  
El alosetrón, se absorbe rápidamente en el tracto gastrointestinal con una biodisponibilidad entre 50-60%.

**Usos Clínicos;**  
El alosetrón está aprobado para el tratamiento de mujeres con IBS grave, en quienes la diarrea es el síntoma predominante.

**Eventos adversos;**  
En contraste con el excelente perfil de seguridad de otros antagonistas del receptor 5-HT<sub>3</sub>, alosetrón se asocia con toxicidad gastrointestinal, rara pero grave.

**Interacción con otros medicamentos;**  
El alosetrón no parece tener interacciones clínicamente significativas con otros fármacos.

Activan la sensación de dolor posterior visceral a través de neuronas sensoriales extrínsecas desde el intestino hasta la médula espinal y el sistema nervioso central, el **alosestrón** es un antagonista 5-HT<sub>3</sub> que ha sido aprobado para el tratamiento de pacientes con IBS grave con diarrea.

## Activadores del canal de Cloruro

Lubiprostona está aprobada para el tratamiento de mujeres con IBS con estreñimiento predominante. Su eficacia para los hombres con IBS no está demostrada. La dosis aprobada para IBS es de 8 mcg dos veces al día