



**Mi Universidad**

NOMBRE DE LA INSTITUCION: UNIVERSIDAD DEL SURESTE.

NOMBRE DE LA ASIGNATURA: FARMACOLOGÍA.

UNIDAD CORRESPONDIENTE: PARCIAL IV.

TEMA: TRATAMIENTO DEL ASMA.

NOMBRE DEL DOCENTE: DR. MIGUEL BASILIO ROBLEDO

NOMBRE DEL ALUMNO: KARINA DESIRÉE RUIZ PÉREZ.

SEMESTRE Y GRUPO: 3B

FECHA DE ENTREGA: 17 DE DICIEMBRE DEL 2023.

# TRATAMIENTO EN EL ASMA

## ¿QUÉ ES?

Es una enfermedad inflamatoria crónica de las vías respiratorias que se manifiesta como una obstrucción bronquial reversible en respuesta a diferentes estímulos.

Lleva a episodios recurrentes de sibilancias, disnea, opresión torácica y tos, sobre todo en la noche o la madrugada.

La inflamación afecta todas las vías respiratorias, incluyendo el tracto superior y la nariz, el efecto fisiológico es más pronunciado en los bronquios de tamaño mediano.

## CLASIFICACIÓN

Leve intermitente, leve persistente, moderada persistente y severa persistente.

## OBJETIVO DEL TRATAMIENTO

Es alcanzar y mantener el control clínico; por tanto, consiste en aplicar broncodilatadores para el control de los síntomas y antiinflamatorios para profilaxis.

## (CONTROLADORES) GLUCOCORTICOIDES

Están considerados como los fármacos de primera línea en el tratamiento del asma persistente y en las crisis agudas. Inhiben la cascada del ácido araquidónico y aumentan el número de receptores beta2.

Glucocorticoides inhalados incluyen a la beclometasona, budesonida, fluticasona.

Glucocorticoides orales el más empleado es la prednisona.

Glucocorticoides intravenosos entre los más utilizados están metilprednisolona, hidrocortisona.

## BECLOMETASONA (INHALADOS)

**FARMACODINAMIA**  
Actúa de modo directo en la mucosa bronquial, inhibe la acción de la fosfolipasa A2 y, por tanto, inhibe la producción y liberación de prostaglandinas, tromboxanos y leucotrienos, con lo que evita el proceso inflamatorio.

**FARMACOCINÉTICA**  
Se administra por vía inhalatoria, después de la inhalación es absorbida a través de la mucosa nasal, tiene una vida media de 30 minutos, se une a proteínas plasmáticas en 87%.

**INDICACIÓN Y DOSIS**  
Se usa como medicamento controlador del asma. La dosis recomendada es de una inhalación cada 8 o 12 horas. Su presentación es en frasco dispositivo inhalador con 200 dosis de 100 mcg/aspiración y con 200 dosis de 250 mcg/aspiración.

**REACCIONES ADVERSAS**  
Incluyen irritación nasal y sequedad de la nariz. Puede presentarse candidiasis oral y faríngea, disfonía, tos por irritación faríngea.

## BUDESONIDA (INHALADOS)

**FARMACODINAMIA**  
Incluyen irritación nasal y sequedad de la nariz. Pudieran presentarse candidiasis oral y faríngea, disfonía, tos por irritación faríngea.

**FARMACOCINÉTICA**  
Se administra por vía inhalatoria, su vida media es de 2 a 3 horas. Se une a las proteínas plasmáticas en 85 a 90%.

**INDICACIÓN Y DOSIS**  
Se usa como fármaco controlador en asma. La dosis recomendada es de una inhalación cada 12h. Se presenta en frasco dosificador con 200 dosis de 100 mcg por dosis y frasco dosificador con 200 dosis de 200 mcg por dosis.

**REACCIONES ADVERSAS**  
Síntomas locales como resequedad de la nariz y estornudos.

**CONTRAINDICACIONES**  
En caso de hipersensibilidad al compuesto.

## FLUTICASONA (INHALADOS)

**FARMACODINAMIA**  
Actúa inhibiendo la producción de leucotrienos y citocinas inflamatorias.

**FARMACOCINÉTICA**  
Se administra por vía inhalatoria, su vida media es de 2 a 3 horas. Se une a las proteínas plasmáticas en 85 a 90%.

**INDICACIÓN Y DOSIS**  
Es el fármaco controlador del asma. La dosis recomendada es de una inhalación cada 12h. Se encuentra en frasco presurizado con 60 y 120 dosis de 50 µg por dosis y también frasco presurizado de 60 a 120 dosis con 250 µg por dosis.

**REACCIONES ADVERSAS**  
Candidiasis bucal y faríngea, disfonía o irritación de garganta.

**CONTRAINDICACIONES**  
En caso de hipersensibilidad al compuesto.

## PREDNISONA (ORAL)

**FARMACODINAMIA**  
Inhibe la inflamación y las respuestas inmunológicas, atraviesa la membrana celular y se une con alta afinidad con los receptores citoplasmáticos, induce la transcripción y síntesis de proteínas específicas y reduce la inflamación y produce una respuesta inmunosupresora.

**FARMACOCINÉTICA**  
Se administra por vía oral, su absorción es en el tubo digestivo y las concentraciones plasmáticas son alcanzadas después de 1 a 2 horas. Se une de forma amplia a las proteínas plasmáticas en especial a la albúmina. Su vida media es de 2 a 4 horas.

**INDICACIÓN Y DOSIS**  
Utilizada en asma severo persistente y en tratamiento del asma de difícil control. La dosis recomendada es de 0.2 a 0.5 mg/kg/día en una sola toma por 7 a 14 días. La prednisona se presenta en tabletas de 5, 20 y 50 mg.

**REACCIONES ADVERSAS**  
Llega a ocurrir retraso en el crecimiento en niños, osteoporosis, hipertensión, hiperglucemia, gastritis e inmunosupresión.

**CONTRAINDICACIONES**  
En presencia de micosis sistémica, tuberculosis activa e hipersensibilidad.

## GLUCOCORTICOIDES INTRAVENOSOS

**INDICACIÓN**  
Están indicados en el control de las crisis asmáticas.

Los más utilizados son metilprednisolona por vía intravenosa a dosis de 1 mg/kg cada 6 horas y la hidrocortisona a dosis de 50 a 100 mg/kg al día, la dosis total diaria por lo general no excede de 1 g.

## MODIFICADORES DE LOS LEUCOTRIENOS

Se forman por la acción de la 5-lipooxigenasa sobre el ácido araquidónico y son sintetizados por varias células que participan en la inflamación respiratoria: eosinófilos, mastocitos, macrófagos y basófilos.

Son antagonistas competitivos de leucotrienos, en especial de los receptores CVALT1 localizados en el músculo liso, leucocitos, linfocitos, eosinófilos y monocitos de las vías respiratorias.

**CONFORMADOS POR:**  
Montelukast, pranlukast y zafirlukast. No deben consumirse solos como controladores, sino añadirse a los glucocorticoides inhalados para así disminuir la dosis de éstos.

## MONTELUKAST

**FARMACODINAMIA**  
Inhibe de manera específica los receptores de cisteinilo-leucotrienos y bloquea la broncoconstricción, secreción mucosa, aumento de la permeabilidad e infiltración de eosinófilos.

**FARMACOCINÉTICA**  
Es administrado por VO, se absorbe con rapidez en el tubo digestivo y las concentraciones plasmáticas son alcanzadas después de 3 a 4 horas. Su vida media es de 3 a 6 horas.

**INDICACIÓN Y DOSIS**  
Se utiliza como terapia adicional del asma leve persistente en pacientes no controlados con corticoides o β-agonistas. La dosis utilizada es de 10 mg una vez al día. El fármaco se presenta en tabletas de 10 mg.

**REACCIONES ADVERSAS**  
Cefaleas y dolor abdominal.

**CONTRAINDICACIONES**  
En caso de hipersensibilidad al fármaco.

# TRATAMIENTO EN EL ASMA

## AGONISTAS B2 DE ACCIÓN PROLONGADA

Son más efectivos cuando se les combina con glucocorticoides inhalados, es el preferido cuando dosis medias de glucocorticoides inhalados han fallado. Añadirlo alivia los síntomas, disminuye el asma nocturna, mejora la función pulmonar y baja el uso de agonista  $\beta_2$  de acción rápida.

Los más utilizados son salmeterol y formoterol, pero es importante subrayar que no deben ser usados como monoterapia en asma, ya que carecen de acción sobre la inflamación de la vía aérea.

## SALMETEROL Y FORMOTEROL

**FARMACODINAMIA**  
Son potentes agonistas  $\beta_2$  selectivos, producen relajación del músculo liso bronquial por activación de la adenilato-ciclasa que aumenta la producción de AMPc, inhiben la liberación de los mediadores de la célula cebada, disminuyen la permeabilidad vascular y aumentan la aclaramiento mucociliar.

### FARMACOCINÉTICA

El formoterol es absorbido con rapidez y las concentraciones plasmáticas son alcanzadas después de 15 minutos. Su vida media es de 8 horas. El salmeterol, su vida media es de 12 horas.

### INDICACIÓN Y DOSIS

Se utilizan como coadyuvantes a glucocorticoide inhalado en el tratamiento de asma persistente. La dosis recomendada de formoterol es una inhalación de 6 a 12 mcg cada 12 o 24 horas. El salmeterol, la dosis recomendada es de una inhalación de 100 a 200 mcg por día.

### REACCIONES ADVERSAS

Son nerviosismo, temblor, taquicardia, calambres musculares e hipocalcemia.

### CONTRAINDICACIONES

Casos de cardiopatía isquémica, insuficiencia cardíaca grave e hipersensibilidad.

## CROMONAS

Conocidos también como "estabilizadores de los mastocitos", son medicamentos usados como profilácticos en el asma y del broncoespasmo inducido por el ejercicio. Su empleo crónico disminuye de manera ligera la reactividad bronquial.

No poseen efecto sobre el tono del músculo liso de las vías respiratorias y no pueden revertir el broncoespasmo asmático. Entre los estabilizadores de los mastocitos están el cromoglicato de sodio y el nedocromil.

## CROMOGLICATO DE SODIO Y NEDOCROMIL

**FARMACODINAMIA**  
Actúan inhibiendo la liberación de mediadores alérgicos e inflamatorios de los mastocitos, incluyendo citocinas, leucotrienos e histamina. Suelen deberse a la inhibición de los canales de cloruro.

### FARMACOCINÉTICA

Son mal absorbidos por vía oral, por lo que se deben aplicar por inhalación.

### INDICACIÓN Y DOSIS

Son utilizados como profilácticos antes de ejercicio o antes de una exposición inevitable a un alérgeno. El cromoglicato de sodio se presenta en dispositivo con 200 dosis de 800 mcg por aspiración y el nedocromil es presentado en dispositivo con 112 dosis medias de 1.75 mg por inhalación.

### REACCIONES ADVERSAS

Irritación de garganta, tos y boca seca.

### CONTRAINDICACIONES

En caso de hipersensibilidad al fármaco.

## METILXANTINAS

Son fármacos que producen relajación directa del músculo liso bronquial. Inhiben la fosfodiesterasa, una enzima que degrada al AMPc.

A este grupo pertenecen la teofilina que se administra por vía oral y la aminofilina que es aplicada vía intravenosa.

## TEOFLINA

**FARMACODINAMIA**  
Relaja la musculatura lisa de los bronquios. Inhibe la fosfodiesterasa ocasionando un incremento en la concentración de AMPc.

### FARMACOCINÉTICA

El fármaco se administra por vía oral. Es absorbido de forma lenta en el tracto gastrointestinal, se une a proteínas plasmáticas en casi 60% y tiene una vida media de 7.7 horas. La vida media del fármaco es mucho menor en niños que en adultos.

### INDICACIÓN Y DOSIS

Es utilizada como coadyuvante con glucocorticoide inhalado en el tratamiento del asma persistente y en especial con síntomas nocturnos. Se debe usar sólo cuando existe manera de medir sus concentraciones. La dosis utilizada es de 3 a 5 mg/kg/día en una sola toma o cada 12 horas.

### REACCIONES ADVERSAS

Insomnio. Otros efectos informados son taquicardia, náuseas, vómito, cefalea, convulsiones, hiperglucemia, hipocalcemia, úlcera péptica.

### CONTRAINDICACIONES

En sujetos con isquemia, insuficiencia cardíaca grave, úlcera péptica y reflujo gastroesofágico.

## MEDICAMENTOS ALIVIADORES (RESCATADORES)

Son fármacos empleados por necesidad, ya que actúan con rapidez al revertir la broncoconstricción y aliviar los síntomas. Incluyen agonistas  $\beta_2$  inhalados de acción corta y anticolinérgicos inhalados de acción corta.

## AGONISTAS B2 INHALADOS DE ACCIÓN CORTA

Son los medicamentos de elección para aliviar el broncoespasmo en las exacerbaciones agudas del asma y para el pretratamiento de broncoconstricción inducida por el ejercicio. Deben ser usados por razón necesaria a dosis baja y con mínima frecuencia. El prototipo es el salbutamol.

## SALBUTAMOL

**FARMACODINAMIA**  
Estimula los receptores  $\beta_2$  adrenérgicos que se localizan en el músculo liso bronquial, causando activación del adenilato-ciclasa que incrementa la producción del AMPc, lo que causa relajación del músculo liso bronquial.

### FARMACOCINÉTICA

Por lo general es administrado por inhalación, se une a las proteínas plasmáticas en 10%. Su vida media es de 4 a 6 horas.

### INDICACIÓN Y DOSIS

Está indicado en asma aguda, premedicación en broncoespasmo inducido por ejercicio. La dosis recomendada es una inhalación de 100 o 200 mcg cada 6 u 8 horas. Es presentado en dispositivo inhalador con 200 dosis y cada dosis proporciona 100 mcg.

### REACCIONES ADVERSAS

Agitación, temblor, nerviosismo, taquicardia, hipocalcemia y cefalea.

### CONTRAINDICACIONES

En caso de cardiopatía isquémica, insuficiencia cardíaca grave e hipertiroidismo.

## ANTICOLINÉRGICOS

Son broncodilatadores eficaces, inhiben de manera competitiva el efecto de la acetilcolina en los receptores muscarínicos y pueden bloquear de modo eficaz la contracción del músculo liso de las vías respiratorias.

Este grupo está conformado por bromuro de ipratropio, tiotropio y atropina.

## BROMURO DE IPRATROPIO

**FARMACODINAMIA**  
Antagoniza de forma competitiva los efectos de la acetilcolina mediante el bloqueo de los receptores colinérgicos muscarínicos e inhibe la broncoconstricción mediada por la acetilcolina.

### FARMACOCINÉTICA

Administrado por inhalación oral o por aplicación intranasal, después de su inhalación oral es absorbido muy poco por los pulmones o por el tracto digestivo. Su vida media es de 2 horas.

### INDICACIÓN Y DOSIS

Está indicado en el tratamiento y prevención de broncoespasmo, así como en combinación con otros broncodilatadores. La dosis recomendada en adultos es de dos pulverizaciones cuatro veces al día. El fármaco es presentado en aerosol, un inhalador de 300 dosis de 18 mcg/aspiración.

### REACCIONES ADVERSAS

Tos. Otros efectos informados incluyen irritación de la garganta, ronquera, disgeusia, náuseas y molestias gástricas.

### CONTRAINDICACIONES

En pacientes con antecedentes de alergia a atropina, bromuros o en caso de hipersensibilidad.

# REFERENCIAS BIBLIOGRÁFICAS

- Chéry, P. M. A., & Mitchel, P. (2013). Manual de Farmacología Básica y Clínica.
- Goodman, L. S. (2019). Las bases farmacológicas de la terapéutica.