



# UNIVERSIDAD DEL SURESTE CAMPUS COMITAN LICENCIATURA MEDICINA HUMANA

**DR. MARTIN PEREZ DURAN**

**FARMACOLOGIA 4 GRADO GRUPO : B**

**PABLO ADOLFO JIMENEZ VAZQUEZ**

**COMITAN DE DOMINGUEZ , CHIAPAS**



**DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:** El periodo máximo recomendado para el uso parenteral es de 2 días. Intramuscular profunda o intravenosa en infusión.

Intramuscular profunda aplicada en el glúteo a una dosis de 75 mg una vez al día o, si se requiere en estados graves 75 mg dos veces al día. El diclofenaco sódico también se utiliza por vía intramuscular en el cólico nefrítico a dosis de 75 mg repetida a los 30 minutos si es preciso

## Insuficiencia hepática Diclofenaco

Contraindicado en I.H. severa. Precaución en I.H. leve a moderada, puede producir elevaciones de enzimas hepáticos; tto. prolongado controlar la función hepática.

## Mecanismo de acción Diclofenaco

Inhibe la biosíntesis de prostaglandinas.

## Contraindicaciones Diclofenaco

Hipersensibilidad a diclofenaco; cuando la administración de AAS u otros AINE haya desencadenado ataques de asma, urticaria o rinitis aguda; enf. de Crohn activa; colitis ulcerosa activa; I.R. grave; I.H.a grave; desórdenes de la coagulación; antecedentes de hemorragia gastrointestinal o perforación relacionados con ttos. anteriores con AINE;

**FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA:** El diclofenaco es un antiinflamatorio no esteroideo (AINE) derivado del ácido fenilacético al igual que otros AINES, inhibe la actividad de la enzima ciclooxigenasa, que da como resultado una disminución en la síntesis de prostaglandinas y tromboxanos procedentes del ácido araquidónico. Las prostaglandinas desempeñan un papel importante en la aparición de la inflamación, el dolor y la fiebre.

Medicamento que se usa para tratar los síntomas de la artritis reumatoide y que está en estudio para la prevención y el tratamiento de algunos tipos

## Modo de administración Diclofenaco

Vía oral. Administrar preferentemente antes de las comidas. Ingerir enteros con algo de líquido, sin masticar. Vía rectal: Se recomienda poner los supositorios después de la evacuación fecal.

Vía parenteral: solución inyectable se administra por vía intramuscular por inyección intraglútea profunda, en el cuadrante superior externo. de cáncer de piel.

## Reacciones adversas Diclofenaco

Cefalea, mareo; vértigo; náuseas, vómitos, diarreas, dispepsia, dolor abdominal, flatulencia, anorexia; erupción; colitis isquémica; irritación en el lugar de aplicación (rectal); reacción, dolor y induración en el lugar de iny. (IM), seguimiento estricto de las instrucciones para la administración IM para evitar reacciones adversas como debilidad muscular,

## RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA:

**Embarazo:** El diclofenaco no debe administrarse durante el embarazo.

**Lactancia:** Debe tenerse precaución si se administra el diclofenaco en mujeres durante el periodo de lactancia, ya que se secreta en cantidades pequeñas por la leche materna.

# IBUPROFENO

## Mecanismo de acción

### Ibuprofeno

Inhibición de la síntesis de prostaglandinas a nivel periférico

## Indicaciones terapéuticas Ibuprofeno

- **VÍA ORAL:** artritis reumatoide (incluyendo artritis reumatoide juvenil), espondilitis anquilopoyética, artrosis y otros procesos reumáticos agudos o crónicos. Alteraciones musculoesqueléticas y traumáticas con dolor e inflamación. Tto. sintomático del dolor leve o moderado (dolor de origen dental, dolor posquirúrgico, dolor de cabeza, migraña). Dismenorrea primaria. Cuadros febriles.

**Contraindicaciones Ibuprofeno** Hipersensibilidad a ibuprofeno o a otros AINE; historial de broncoespasmo, asma, rinitis,

## Modo de administración

### Ibuprofeno

Vía oral. Administrar con comidas o con leche especialmente si se notan molestias digestivas.

Vía IV: administrar como una perfus. IV durante 30 min.

## Dosis oral usual en niños:

- Tratamiento del dolor y la fiebre: 5-10 mg por kg de peso cada 8 horas, hasta un máximo de 40 mg por kg de peso al día.
- Tratamiento de procesos inflamatorios: 10 mg por kg de peso cada 6 horas

El **ibuprofeno alivia el dolor y baja la fiebre**. En algunos pacientes suele ser más efectivo para aliviar el dolor de corta duración de tipo menstrual, dental, de garganta, esguinces o torceduras. El consumo continuado de ibuprofeno puede dañar el estómago. Para evitarlo, se recomienda tomarlo con alimentos.



## Insuficiencia hepática Ibuprofeno

Contraindicado en I.H. grave. Precaución en I.H. leve-moderada, reducir dosis inicial.

## Reacciones adversas

### Ibuprofeno

úlceras pépticas, perforación y hemorragia gastrointestinal, náuseas, vómitos, diarrea, flatulencia, estreñimiento, dispepsia, dolor abdominal, melena, hematemesis, estomatitis ulcerativa, exacerbación de colitis ulcerosa y enf. de Crohn; fatiga o somnolencia

## DESCRIPCION

La indometacina es un fármaco anti-inflamatorio no esteroídico, perteneciente a la familia de derivados del ácido indolacético. Con propiedades analgésicas y antipiréticas se usa principalmente en el tratamiento de la artritis reumatoide, aunque otros usos son la dismenorrea primaria, artritis juvenil, síndrome de Reiter, enfermedad de Paget, pseudogota aguda, dolor torácico pleurítico y pericarditis. En los neonatos prematuros, acelera el cierre del ductus arteriosus patente

## Contraindicaciones

### Indometacina

Hipersensibilidad a indometacina y/o otros AINE; úlcera duodenal activa, historia de lesiones gástricas recurrentes; embarazo; lactancia; niños < 14 años. Además, historial reciente de proctitis (rectal).

## Advertencias y precauciones

### Indometacina

Ancianos, alteraciones psiquiátricas, epilepsia, enf. de Parkinson, alteración de coagulación o bajo tto. con anticoagulantes, I.R., I.H., insuf.

# INDOMETACINA

## Reacciones adversas

### Indometacina

Cefalea, mareo, aturdimiento, depresión, vértigo y fatiga, náuseas, anorexia, vómitos, molestias epigástricas, dolor abdominal, estreñimiento, diarrea, ulceraciones en esófago, duodeno e intestino delgado, hemorragia gastrointestinal sin evidencia de úlcera y aumento del dolor abdominal en pacientes con colitis ulcerosa preexistente.

**FARMACOCINÉTICA:** la absorción de la indometacina desde el tracto digestivo es rápida y completa. Biodisponibilidad es aproximadamente del 90% tanto para la formulación convencional como para la formulación de liberación sostenida, si bien la absorción es más lenta en este último caso. Por vía rectal, la absorción de la indometacina es aún más rápida que por vía oral, aunque la cantidad absorbida es algo menor. Cuando se administra con antiácidos o con alimentos, las concentraciones plasmáticas son algo menores. La indometacina se une extensamente a las proteínas del plasma (99%). Cruza fácilmente la barrera placentaria y se distribuye en la leche materna, entrando pequeñas cantidades en el sistema nervioso central

**TOXICIDAD:** en los estudios de carcinogénesis de 81 semanas de duración en dosis de hasta 1 mg/kg/día la indometacina no mostró ningún efecto tumorigénico. Tampoco se han observado cambios neoplásicos o hiperplásicos en la rata (73 a 110 semanas de tratamiento) ni en el ratón (62 a 88 semanas de tratamiento) con dosis de 1.5 mg/kg/día.

**MECANISMO DE ACCIÓN:** los efectos anti-inflamatorios de la indometacina se deben a la inhibición de la síntesis de prostaglandinas y a la inhibición de la migración leucocitaria a las áreas inflamadas. Pero además otros mecanismos que contribuyen a su actividad anti-inflamatoria son la inhibición de las fosfodiesterasas con el consiguiente aumento de las concentraciones intracelulares del adenosin monofosfato y la interferencia con la producción de anticuerpos inflamatorios



**CONTRAINDICACIONES:** El naproxeno está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad a las fórmulas que contienen naproxeno y naproxeno sódico. Tampoco deberá administrarse en personas con hipersensibilidad al ácido acetilsalicílico o a otros antiinflamatorios no esteroideos.

El naproxeno no deberá usarse durante el embarazo ni en pacientes con sangrado gastrointestinal.

**RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA:** No se administre durante el embarazo y la lactancia.

**REACCIONES SECUNDARIAS Y ADVERSAS:** Las reacciones secundarias que aparecen con mayor frecuencia son: dolor epigástrico, distensión abdominal, pirosis, náuseas, cefalea, vértigo, edema periférico, tinnitus y disnea.

Con menor frecuencia se presentan estomatitis ulcerativa, sed, palpitaciones, sudoración aumentada, disminución o pérdida del apetito y diarrea.

#### **Insuficiencia hepática**

#### **Naproxeno**

Contraindicado en I.H. grave. Precaución en I.H.

#### **Insuficiencia**

#### **renal Naproxeno**

Contraindicado en I.R. grave. Precaución en I.R.

**EL NAPROXENO** de venta libre se usa para reducir la fiebre y aliviar los dolores leves por cefaleas, dolores musculares, artritis, periodos menstruales, resfriado común; dolor de muelas y dolor de espalda.

#### **Modo de administración Naproxeno**

Vía oral. Administrar enteros, con leche o comida, especialmente si se notan molestias digestivas.

**INDICACIONES TERAPÉUTICAS:** El naproxeno es un antiinflamatorio no esteroideo con acciones analgésicas y antirreumáticas. Además, está indicado en dismenorrea primaria y para los ataques de gota.

#### **INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS Y DE OTRO**

**GÉNERO:** El uso concomitante de naproxeno y la hidantoína pueden requerir ajuste de la dosis debido a la elevada unión a proteínas del primero. Se ha llegado a reportar que el litio puede aumentar su concentración sérica debido a inhibición de la eliminación renal de éste por el naproxeno.

**FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA:** El naproxeno es un antiinflamatorio no esteroideo que inhibe la actividad de la enzima ciclo-oxigenasa, que da como resultado una disminución en la síntesis de prostaglandinas y tromboxanos procedentes del ácido araquidónico. Puede actuar en forma periférica en los tejidos inflamados probablemente mediante la reducción de la actividad de las prostaglandinas en estos tejidos y posiblemente mediante inhibición de la síntesis y/o acciones sobre otros mediadores locales de la respuesta inflamatoria. También pueden estar involucradas la inhibición de la migración de los leucocitos, inhibición de la liberación y/o acciones de las enzimas lisosomales y acciones sobre otros procesos celulares e inmunológicos en el tejido mesenquimatoso y conectivo



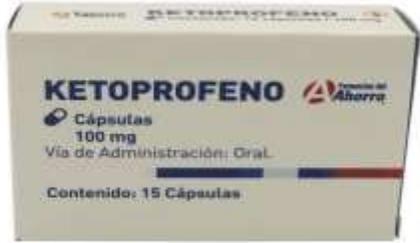
**DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:** La vía de administración es oral.

La dosis inicial en adultos con artritis reumatoide, osteoartritis o espondilitis anquilosante es de 1000 mg repartidos en 2 a 3 dosis al día. La dosis de mantenimiento es de 500 mg a 1000 mg al día repartidos en 2 a 3 dosis.

En los tratamientos a largo plazo es conveniente realizar ajustes en la dosis de acuerdo a la respuesta de cada caso en particular, puesto que con frecuencia dosis menores son suficientes. En las etapas agudas de los padecimientos reumáticos pueden llegar a usarse dosis de hasta 1500 mg al día durante periodos cortos.

– **Como antiinflamatorio y para la dismenorrea se recomienda:** Una toma inicial de 500 mg y continuar con 250 mg cada 6 a 8 horas.

– **Para el alivio de los síntomas de la gota:** Iniciar con 750 mg y continuar con 250 mg cada 6 a 8 horas hasta que haya cedido el ataque.



**Mecanismo de acción:** Los efectos antiinflamatorios de ketoprofeno son la consecuencia de la inhibición periférica de la síntesis de prostaglandinas secundaria a la inhibición de la enzima ciclooxigenasa. Las prostaglandinas sensibilizan los receptores del dolor y la inhibición de la síntesis de prostaglandinas se cree que es responsable de los efectos analgésicos de ketoprofeno. La mayoría de los AINEs no modifican el umbral del dolor ni afectar a las prostaglandinas existentes, y por lo tanto, la acción analgésica es más probablemente periférica.

## **INDICACIONES Y POSOLOGIA**

### **Tratamiento de la artritis reumatoide o la osteoartritis:**

Administración oral

- Adultos: Inicialmente, 200 mg por vía oral por día en 4 dosis: las dosis de mantenimiento habituales son de 150-300 mg por vía oral por día en 3-4 dosis divididas. La dosis debe ajustarse de acuerdo a las necesidades del paciente y la respuesta. La dosis máxima es de 300 mg/día.
- Ancianos o pacientes con hipoalbuminemia: La dosis inicial usual debe reducirse en un 33-55% en los ancianos (ver dosis para adultos)
- Niños: La dosis de seguridad no ha sido establecida.

## **REACCIONES ADVERSAS**

La dispepsia se presenta en aproximadamente el 12% de los pacientes tratados con ketoprofen y es la más frecuente reacción adversa gastrointestinal. También son frecuentes las náuseas/vómitos, dolor abdominal, diarrea, estreñimiento y flatulencia son (3-9%). Las reacciones más graves (<1%) incluyen gastritis, hemorragia rectal, úlcera péptica, sangrado gastrointestinal, perforación gastrointestinal, hematemesis, y ulceración intestinal, que no pueden ser precedidos por otros síntomas.

**DESCRIPCION** El ketoprofen es un agente antiinflamatorio no esteroideo que también posee propiedades analgésicas y antipiréticas. Está química y farmacológicamente relacionado con el ibuprofeno. El ketoprofeno está indicado para el tratamiento sintomático de la artritis reumatoide y la osteoartritis, siendo también eficaz en el alivio de dolor leve a moderado y en la dismenorrea. Los estudios clínicos han demostrado su eficacia en el tratamiento de la espondilitis anquilosante, artritis gotosa aguda, bursitis y / o la tendinitis y el síndrome de Reiter.

**Farmacocinética:** El ketoprofeno se administra por vía oral, y la absorción en el tracto gastrointestinal es rápida y casi completa. La administración con alimentos o leche disminuye la velocidad, pero no la extensión, de la absorción. La biodisponibilidad es aproximadamente del 90%, alcanzándose concentraciones plasmáticas máximas en 1 hora. La analgesia se produce al cabo de 1-2 horas y se mantiene durante 3-4 horas. Los efectos terapéuticos para los pacientes con artritis reumatoide y osteoartritis duran más de lo que cabe esperar de la vida media del fármaco, que es 1,1-4 horas.

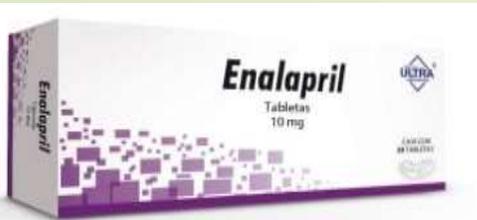
## **PRESENTACIONES**

Orudis®, caps. 50 mg; comp.50 y 100 mg; sup. 200 mg; amp. 100 mg/2ml  
Ketoprofeno Ratiopharm, caps. 50 mg

## **CONTRAINDICIONES**

El uso crónico de ketoprofen puede provocar gastritis, úlcera, con o sin perforación y/o hemorragia gastrointestinal. Ambas pueden ocurrir en cualquier momento, a menudo sin síntomas anteriores. Por lo tanto, el ketoprofen se debe utilizar con precaución en pacientes con antecedentes de enfermedad activa o gastrointestinal incluyendo la úlcera péptica, la colitis ulcerativa, o hemorragia gastrointestinal. El tabaquismo y el alcoholismo pueden aumentar el riesgo de úlceras gastrointestinales inducidas por ketoprofen. Los pacientes no deben automedicarse con ketoprofen si consumen 3 o más bebidas alcohólicas al día. Todos los pacientes que reciben tratamiento prolongado deben ser controlados rutinariamente para corroborar la presencia de ulceración y sangrado del tracto digestivo

# ANTIHIPERTENSIVOS



## Modo de administración

### Enalapril

Vía oral. Administrar con o sin alimentos

El ENALAPRIL controla la presión arterial alta y la insuficiencia cardíaca

## Insuficiencia hepática

### Enalapril

Precaución. Si se presenta ictericia o elevaciones marcadas de enzimas hepáticas, interrumpir tto. y realizar seguimiento apropiado.

## Mecanismo de acción

### Enalapril

Inhibidor del ECA da lugar a concentraciones reducidas de angiotensina II, que conduce a disminución de la actividad vasopresora y secreción reducida de aldosterona.

## Reacciones adversas

### Enalapril

Cefalea, depresión; visión borrosa; mareos, hipotensión (incluyendo hipotensión ortostática), síncope, IAM o ACV, dolor torácico, trastornos del ritmo cardíaco, angina de pecho, taquicardia; tos, disnea; náuseas, diarrea, dolor abdominal, alteración del gusto; erupción cutánea, hipersensibilidad/edema angioneurótico (edema angioneurótico de la cara, extremidades, labios, lengua, glotis y/o laringe); astenia, fatiga; hiperpotasemia, aumentos en la creatinina sérica

## DESCRIPCIÓN

El Enalaprilato es un inhibidor de la enzima de conversión de la angiotensina (ECA). El enalapril, es un pro-fármaco del enalaprilato diseñado para su administración oral.

**Farmacocinética y metabolismo:** Después de la administración oral del enalapril se observan unas concentraciones séricas máximas al cabo de 1 hora. A partir de los datos de la excreción urinaria, se deduce que el enalapril se absorbe en un 60% aproximadamente. La absorción del enalapril no es afectada por la presencia de alimento en el tracto digestivo.

## Hipertensión arterial esencial:

Administración oral

•Adultos: la dosis inicial recomendada es de 5 mg, administrada una vez al día. La dosis usual de mantenimiento es de 20 mg una vez al día. Esta dosis debe ajustarse según las necesidades del paciente. En pacientes de edad mayor o igual a 65 años, la dosis inicial recomendada es de 2,5 mg

**Farmacodinamia:** la administración de enalapril a pacientes con hipertensión ligera a moderada ocasiona la reducción de la presión arterial tanto en posición supina como de pie, sin que se observe un componente ortostático. La hipotensión postural sintomática es infrecuente, aunque puede darse en pacientes con depleción de volumen.

Función renal	Aclaramiento de creatinina	Dosis inicial
Alteración leve	Entre 80 y 30 ml/min.	5 mg/día
Alteración moderada	Entre 30 y 10 ml/min.	2,5-5 mg/día
Alteración severa (normalmente estos pacientes estarán en programa de hemodiálisis)	Menos de 10 ml/min.	2,5 mg los días de diálisis*



## PRESENTACIONES

MICARDIS®Telmisartán comp. 20 y 40 mg

## DESCRIPCION

El telmisartán es un antagonista del receptor de la angiotensina II, similar al valsartán y al losartán, indicado para el tratamiento de la hipertensión. Al igual que otros antagonistas del receptor de la angiotensina II, el telmisartán no afecta significativamente la glucosa en sangre o el metabolismo de los lípidos. Cuando se administra en dosis de 40-160 mg una vez al día, el telmisartán es al menos tan eficaz como lisinopril 10-40 mg/día, y la amlodipina 5 o 10 mg/día en la reducción de la presión arterial sistólica y diastólica en pacientes con hipertensión leve a moderada.

## REACCIONES ADVERSAS

El telmisartán es generalmente bien tolerado. Las reacciones adversas son generalmente leves y transitorias y sólo en contadas ocasiones han requerido la interrupción del tratamiento. En ensayos comparativos con placebo en 1.041 pacientes tratados con diferentes dosis de telmisartán en monoterapia de hasta 12 semanas, la incidencia global de acontecimientos adversos fue similar a la observada con placebo. En los ensayos clínicos, fue necesaria la interrupción del tratamiento debido a eventos adversos en el 2,8% de los pacientes tratados con telmisartán y en 6,1% de los 380 pacientes tratados con placebo.

**Mecanismo de acción:** el telmisartán es un antagonista de angiotensina II (AG II) en el subtipo de receptor AT1. Se han identificado dos receptores de la angiotensina II, AT1 y AT2. El telmisartán tiene una afinidad 3000 veces para el subtipo AT1 que el subtipo AT2, que no es un mediador de la homeostasis cardiovascular.

**Farmacocinética:** el telmisartán se administra por vía oral. Después de la administración oral, las concentraciones máximas se alcanzan aproximadamente a las 0,5-1 horas. El inicio de la actividad antihipertensiva se produce dentro de las 3 horas después de la administración de una dosis oral única. La biodisponibilidad absoluta de telmisartán es dependiente de la dosis. Después de la administración de 40 mg y 160 mg, la biodisponibilidad absoluta es de aproximadamente 42% y 58%, respectivamente. La comida reduce ligeramente la biodisponibilidad de telmisartán, con una reducción en el AUC de aproximadamente el 6% con el comprimido de 40 mg y aproximadamente el 20% después de una dosis de 160 mg.

## CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

El telmisartán se debe utilizar con precaución en pacientes con hipovolemia, incluidos los pacientes que reciben altas dosis de diuréticos, debido a un aumento del riesgo de hipotensión sintomática, especialmente después de administración de la primera dosis. La depleción de volumen deberá corregirse antes de la administración de telmisartán.

**Toxicidad:** en los estudios de toxicidad crónica en los que el telmisartán se administró en la dieta no hubo evidencia de carcinogenicidad con las dosis más altas de 1.000 mg/kg/día en los ratones y 100 mg/kg/día en las ratas. Estas dosis son equivalentes a 59 y 13 veces las dosis terapéuticas máximas en humanos.

## Tratamiento de la hipertensión en monoterapia o en combinación con otros agentes antihipertensivos

Administración oral:

- Adultos: Inicialmente, 40 mg por vía oral una vez al día, a menos que el paciente se encuentre con depleción de volumen. En estos pacientes (por ejemplo, los pacientes que toman diuréticos) comenzar el tratamiento con 20 mg PO una vez al día. El intervalo de dosificación es de 20-80 mg/día PO una vez al día. La máxima reducción de la presión arterial se produce generalmente después de 4 semanas. Si la presión arterial no se controla sólo con el telmisartán, se puede añadir un diurético (por ejemplo, hidroclorotiazida)
- Ancianos: Ver dosis de adulto. No es necesario ajustar la dosis.
- Adolescentes y niños: El uso seguro y eficaz no se ha establecido.



## DESCRIPCIÓN

El captopril es el primero de los fármacos inhibidores de la enzima convertidora de angiotensina. Se utiliza en el tratamiento de la hipertensión.

**Mecanismo de acción:** Los efectos beneficiosos del captopril en la hipertensión y la insuficiencia cardíaca parecen resultar fundamentalmente de la supresión del sistema renina-angiotensina- aldosterona, produciendo una reducción de las concentraciones séricas de angiotensina II y aldosterona. Sin embargo no existe una correlación consistente entre los niveles de renina y la respuesta al fármaco. La reducción de angiotensina II produce una disminución de la secreción de aldosterona, y, por ello, se pueden producir pequeños incrementos de potasio sérico, junto con pérdidas de sodio y fluidos.

**Farmacocinética:** El captopril se absorbe rápidamente del tracto gastrointestinal alcanzándose el pico de niveles plasmáticos aproximadamente en una hora. La absorción mínima es del 75% por término medio. La presencia de alimentos en el tracto gastrointestinal reduce la absorción en un 30-40%: por tanto, captopril debe administrarse una hora antes de la ingesta.

**Toxicidad:** No hubo evidencia de efectos carcinogénicos en estudios realizados en rata y ratón, de 2 años de duración, en los que se administraron dosis de 50 a 1.350 mg/kg/día de captopril. Los estudios de toxicidad crónica oral se realizaron en rata, ratón, perro y mono.

**Insuficiencia cardíaca:** el captopril está indicado en el tratamiento de la insuficiencia cardíaca. Aunque su efecto terapéutico no requiere la presencia de digital, en la mayor parte de los ensayos clínicos realizados el paciente recibía diuréticos y digital junto con captopril.

## CONTRAINDICACIONES y PRECAUCIONES

El captopril está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad a este medicamento o a cualquier inhibidor de la enzima conversora de la angiotensina (IECA) (por ejemplo, pacientes que hayan presentado angioedema durante la terapia con cualquier IECA).

## INDICACIONES y POSOLOGIA

### Hipertensión:

El captopril está indicado en el tratamiento de la hipertensión. El captopril es eficaz solo o en combinación con otros agentes antihipertensivos, especialmente con los diuréticos tiazídicos. Los efectos hipotensores del captopril y de las tiazidas son prácticamente aditivos.

Antes de iniciar el tratamiento con el captopril deben considerarse: el tratamiento antihipertensivo reciente, las cifras tensionales, la restricción de sal en la dieta y otras situaciones clínicas. Si es posible, deberá retirarse la medicación antihipertensiva previa una semana antes del inicio del tratamiento con captopril.

**Reacciones anafilactoides durante la diálisis de alto flujo y la aféresis de lipoproteínas:** se han descrito casos de aparición de reacciones anafilactoides en pacientes hemodializados con membranas de diálisis de alto flujo. También se han detectado reacciones anafilactoides en pacientes que estaban siendo tratados mediante aféresis de lipoproteínas de baja densidad por absorción con sulfato de dextrano. En estos pacientes debe considerarse la utilización de otro tipo de membrana de diálisis o de medicación.



## DESCRIPCION

El quinapril (en forma de clorhidrato) es un inhibidor de la enzima convertidora de la angiotensina (ECA), activo por vía oral, que se usa en el tratamiento de la hipertensión y la insuficiencia cardíaca. Igual que el ramipril, el quinapril es un profármaco que requiere desesterificación al quinaprilato, el metabolito activo. El quinaprilato es triple más potente que el compuesto original. La actividad antihipertensiva del quinapril es suficientemente extensa como para permitir la dosificación una vez al día. El quinapril no contiene un grupo sulfhidrilo, un grupo que tiene implicaciones en cuanto al perfil de reacciones adversas del fármaco.

## Modo de administración

### Quinapril

Vía oral. Administrar durante o después de las comidas

## Reacciones

### adversas

### Quinapril

Hiperpotasemia; insomnio; mareo, cefalea, parestesia; hipotensión; disnea, tos; vómitos, diarrea, dispepsia, dolor abdominal, náuseas; dolor de espalda, mialgia; fatiga, astenia, dolor torácico; creatina y urea elevada en sangre; faringitis, rinitis. Se han identificado como nuevas reacciones adversas psoriasis, psoriasis exacerbada e hiponatremia.

## Mecanismo de acción

### Quinapril

Inhibe la ECA circulante y tisular, disminuyendo la vasoconstricción y la secreción de aldosterona.

**Farmacocinética:** después de la administración oral, quinapril se absorbe rápidamente convirtiéndose en quinaprilato. Los niveles séricos máximos del quinapril se alcanzan en 1 hora y los niveles pico de quinaprilato alcanzan en 1.6 horas. La administración con alimentos disminuye la velocidad pero no el grado de absorción. Aproximadamente el 60% de una dosis de quinapril es absorbida, produciéndose la hidrólisis en el tracto GI y en el hígado. La disfunción renal reduce el aclaramiento de quinaprilato. La semi-vida del quinaprilato es 2.25 horas en pacientes con función renal normal, el tiempo suficiente para permitir la dosificación una vez al día. En los pacientes con insuficiencia renal, efectos hipotensores persisten durante más de 24 horas

## INTERACCIONES

El quinapril puede aumentar los efectos de otros agentes antihipertensivos, incluyendo los diuréticos. Este efecto aditivo puede ser deseable, pero las dosis deben ser ajustadas en consecuencia. Los pacientes con depleción de sodio o hipovolemia son más susceptibles al desarrollo de una insuficiencia renal reversible al recibir el quinapril y un tratamiento diurético concomitante.

## PRESENTACION

ACCUPRIL® Quinapril comp 10 y 20 mg



El **ATENOLOL** pertenece a una clase de medicamentos llamados betabloqueantes Su acción consiste en relajar los vasos sanguíneos y desacelerar el ritmo cardíaco para mejorar el flujo sanguíneo y disminuir la presión arterial

### **Contraindicaciones**

#### **Atenolol**

Hipersensibilidad a atenolol, bradicardia, shock cardiogénico, hipotensión, acidosis metabólica, trastornos graves de circulación arterial periférica, bloqueo cardíaco de 2º o 3º grado, síndrome del seno enfermo, feocromocitoma no tratado, insuf. cardíaca no controlada

#### **Reacciones**

##### **adversas Atenolol**

Bradicardia; extremidades frías; trastornos gastrointestinales; fatiga

### **Contraindicaciones**

#### **Atenolol**

Hipersensibilidad a atenolol, bradicardia, shock cardiogénico, hipotensión, acidosis metabólica, trastornos graves de circulación arterial periférica, bloqueo cardíaco de 2º o 3º grado, síndrome del seno enfermo, feocromocitoma no tratado, insuf. cardíaca no controlada

**Angina de pecho:** La dosis inicial es de 50 mg al día. Si no se consigue una respuesta óptima en el plazo de una semana, la dosis debe incrementarse a 100 mg en una dosis única diaria. Algunos pacientes requieren una dosis de 200 mg una vez al día para conseguir el efecto óptimo. La eficacia antianginosa no se ve incrementada al aumentar esta dosis. El tratamiento se suspenderá de forma gradual advirtiéndole al paciente de limitar su actividad física al mínimo.

### **PRESENTACIONES**

ATENOLOL NORMON 50 mg. Envases con 30 y 60 comprimidos

ATENOLOL NORMOL 100 mg. Envases con 30 y 60 comprimidos

ATENOLOL RATIOPHARM 100 mg. Envases con 30 comprimidos

BLOCKIUM 50 mg. Envases con 30 y 60 comprimidos

BLOCKIUM 100 mg. Envases con 30 comprimidos

[TENORMIN 50 mg](#). Envases con 30 y 60 comprimidos

TENORMIN 100 mg. Envases con 30 comprimidos

### **INTERACCIONES**

El Atenolol no se debe administrar antes de los 7 días posteriores a la suspensión de tratamiento con cada uno de los fármacos que se indican a continuación:

- Verapamil y bepridil: la administración concomitante puede producir bradicardia, bloqueo cardíaco y aumento de la presión diastólica final del ventrículo izquierdo.

# ANTIBIOTICOS



## DESCRIPCION

La amoxicilina es una penicilina semi-sintética similar a la ampicilina, con una mejor biodisponibilidad por vía oral que esta última. Debido a su mejor absorción gastrointestinal, la amoxicilina ocasiona unos mayores niveles de antibiótico en sangre y unos menores efectos gastrointestinales (en particular, diarrea) que la ampicilina. La amoxicilina tiene un espectro de actividad antibacteriana superior al de la penicilina, si bien no es estable frente a las beta-lactamasas.

**Mecanismo de acción:** los antibióticos beta-lactámicos como la amoxicilina son bactericidas. Actúan inhibiendo la última etapa de la síntesis de la pared celular bacteriana uniéndose a unas proteínas específicas llamadas PBPs (*Penicillin-Binding Proteins*) localizadas en la pared celular. Al impedir que la pared celular se construya correctamente, la amoxicilina ocasiona, en último término, la lisis de la bacteria y su muerte. La amoxicilina no resiste la acción hidrolítica de las beta-lactamasas de muchos estafilococos, por lo que no se usa en el tratamiento de estafilococias. Aunque la amoxicilina es activa frente a los estreptococos, muchas cepas se están volviendo resistentes mediante mecanismos diferentes de la inducción de b-lactamasas

**Farmacocinética:** la amoxicilina es estable en medio ácido en presencia de jugos gástricos y puede ser administrada por vía oral in tener en cuenta el ritmo de las comidas. Se absorbe rápidamente después de la administración oral, alcanzando los niveles máximos en 1-2.5 horas. Difunde adecuadamente en la mayor parte de los tejidos y líquidos orgánicos. No difunde a través de tejido cerebral ni líquido cefalorraquídeo, salvo cuando están las meninges inflamadas

## Tratamiento de infecciones moderadas a severas por gérmenes sensibles:

Administración oral:

- Adultos, adolescentes y niños de más de 40 kg: las dosis recomendadas son de 500 mg cada 12 horas o 250 mg cada 8 horas. En el caso de infecciones muy severas o causadas por gérmenes menos susceptibles, las dosis pueden aumentarse a 500 mg cada 8 horas.
- Lactantes y niños de < 40 kg: para infecciones moderadas, las dosis recomendadas sob de 20 mg/kg/día divididos en dosis cada 8 horas o 25 mg/kg/día en dosis cada 12 horas. Estas dosis se pueden aumentar hasta 40 mg/kg/día en tres administraciones o a 45 mg/kg/día en dos administraciones.

**INDICACIONES Y POSOLOGIA** La amoxicilina está indicada en el tratamiento de infecciones sistémicas o localizadas causadas por microorganismos gram-positivos y gram-negativos sensibles, en el aparato respiratorio, tracto gastrointestinal o genitourinario, de piel y tejidos blandos, neurológicas y odontoestomatológicas. También está indicado en la enfermedad o borreliosis de Lyme, en el tratamiento de la infección precoz localizada (primer estadio o eritema migratorio localizado) y en la infección diseminada o segundo estadio

## REACCIONES ADVERSAS

Los efectos secundarios más frecuentes son los asociados a reacciones de hipersensibilidad y pueden ir desde rash sin importancia a serias reacciones anafilácticas. Se ha descrito eritema multiforme, dermatitis exfoliativa, rash maculopapular con eritema, necrosis epidérmica tóxica, síndrome de Stevens-Johnson, vasculitis y urticaria



 Requiere receta médica.

## DESCRIPCION

La ciprofloxacina es un agente antimicrobiano de la clase de las fluoroquinolonas. Es activo frente a un amplio espectro de gérmenes gram-negativos aerobios, incluyendo patógenos entéricos, *Pseudomonas* y *Serratia marcescens*, aunque ya han empezado a aparecer cepas de *Pseudomonas* y *Serratia* resistentes. Igualmente es activo frente a gérmenes gram-positivos, aunque también se han detectado resistencias en algunas cepas de *Staphylococcus aureus* y pneumococos. No es activo frente a gérmenes anaerobios. Se utiliza ocasionalmente, en combinación con otros antibacterianos, en el tratamiento de las infecciones por micobacterias (*M. tuberculosis* y MAC).

**Mecanismo de acción:** los efectos antibacterianos de la ciprofloxacina se deben a la inhibición de la topoisomerasa IV y la DNA-girasa bacterianas. Estas topoisomerasas alteran el DNA introduciendo pliegues super helicoidales en el DNA de doble cadena, facilitando el desenrollado de las cadenas. La DNA-girasa tiene dos subunidades codificadas por el gen *gyrA*, y actúan rompiendo las cadenas del cromosoma bacteriano y luego pegándolas una vez que se ha formado la superhélice. Las quinolonas inhiben estas subunidades impidiendo la replicación y la transcripción del DNA bacteriano

## CONTRAINDICACIONES

La ciprofloxacina no debe ser utilizada en pacientes con hipersensibilidad a las quinolonas. Las fluoroquinolonas producen artropatías cuando se administran a animales inmaduros, lo que hace necesario tomar precauciones cuando se administra en pediatría, aunque la incidencia de artralgias es inferior a 1,5% y éstas desaparecen cuando se discontinúa el tratamiento. Las fluoroquinolonas han sido asociadas a rupturas de tendones, por lo que se debe discontinuar el tratamiento con ciprofloxacina tan pronto como aparezca dolor tendinoso.

**Farmacocinética:** la ciprofloxacina se administra por vía oral e intravenosa. Después de una dosis oral, la ciprofloxacina se absorbe rápidamente en el tracto digestivo, experimentando un mínimo metabolismo de primer paso. En voluntarios en ayunas se absorbe el 70% de la dosis, alcanzándose las concentraciones plasmáticas máximas en 0.5 a 2.5 horas

## INTERACCIONES

La ciprofloxacina reduce el aclaramiento hepático de la cafeína y de la teofilina, pudiendo desarrollarse síntomas tóxicos como náuseas/vómitos, nerviosismo, ansiedad, taquicardia o convulsiones. Esta interacción es dosis-dependiente, por lo que los sujetos que consuman grandes cantidades de café deben prestar particular atención.

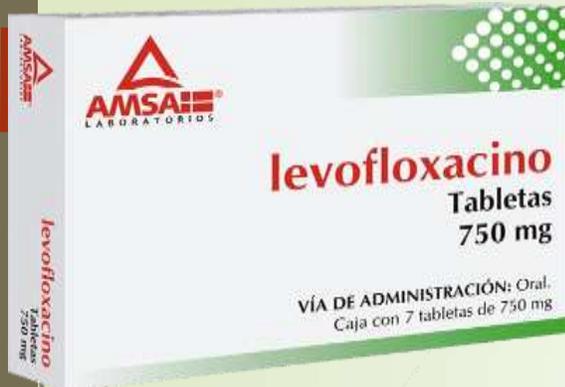
## REACCIONES ADVERSAS

En general la ciprofloxacina es bien tolerada siendo la incidencia de las reacciones adversas graves inferior al 5%. La ciprofloxacina se debe utilizar con precaución en niños de menos dieciséis años debido a las artralgias que pueden desarrollar, en particular cuando éstas están asociadas a fibrosis quística.

## PRESENTACION

- BAYCIP, comp 250 mg, 500 mg y 750 mg. BAYER
- CETRAXAL Comp. recub. 500 mg y 750 mg SALVAT
- CETRAXAL PLUS Gotas, sol. ótica 3 mg/ml SALVAT
- CIPROXINA SIMPLE Gotas óticas 3 mg/ml ALCON-CUSI
- CUNESIN Comp. recub. 250 mg, 500 mg y 750 mg RECORDATI
- OFTACILOX Pomada oft. 3 mg/g ALCON-CUSI
- PIPROL Comp. recub. 250 mg, 500 mg y 750 mg ELFAR-DRAG
- PIPROL Susp. oral 500 mg ELFAR-DRAG
- OFTACILOX Colirio 0,35% ALCON-CUSI
- SYNALOTIC Gotas, sol. ótica YAMANOUCHI

# LEVOFLOXACINO



## DESCRIPCION

La levofloxacina es el isómero L de la ofloxacina, una fluoroquinolona antibacteriana, utilizada en el tratamiento de infecciones producidas por gérmenes sensibles. En comparación con el racémico, la levofloxacina muestra una semi-vida plasmática más larga lo que permite una sola administración al día, siendo además unas dos veces más potente frente a gérmenes gram-positivos y gram-negativos, incluyendo el bacilo tuberculoso. Las *Pseudomonas aeruginosas* y los enterococos faecalis son sólo moderadamente susceptibles, mientras que la *Serratia marcescens* es resistente.

**Mecanismo de acción:** la levofloxacina inhibe la topoisomerasa IV y la DNA-girasa bacterianas. Estas topoisomerasas alteran el DNA introduciendo pliegues super helicoidales en el DNA de doble cadena, facilitando el desenrollado de las cadenas. La DNA-girasa tiene dos subunidades codificadas por el gen *gyrA*, y actúan rompiendo las cadenas del cromosoma bacteriano y luego pegándolas una vez que se ha formado la superhélice. Las quinolonas inhiben estas subunidades impidiendo la replicación y la transcripción del DNA bacteriano. Las células humanas y de los mamíferos contienen una topoisomerasa que actúa de una forma parecida a la DNA-girasa bacteriana, pero esta enzima no es afectada por las concentraciones bactericidas de las quinolonas.

**Antibiograma:** se recomienda la realización de un test de susceptibilidad mediante el método de la difusión en agar utilizando discos con una carga de 5 mg de levofloxacina. Según los diámetros de los halos de inhibición, los microorganismos se clasifican como:

- sensibles: diámetro del halo de inhibición  $\geq 17$  mm
- moderadamente sensibles: diámetro del halo de inhibición 14 - 16 mm
- resistentes:  $\leq 13$  mm

## REACCIONES ADVERSAS

La incidencia total de efectos adversos observados durante los estudios clínicos controlados con la levofloxacina asciende al 6,2%. Los más frecuentes son náusea/vómitos (8.7%), diarrea (5.4%), cefaleas (5.4%) y constipación (3,1%). La cefalea también es frecuente cuando la levofloxacina se administra por vía oftálmica. Otros efectos adversos observados en menos del 1% de los pacientes han sido insomnio (2,9%), mareos (2,5%), dolor abdominal, (2%), dispepsia (2%), rash maculopapular (1,7%), vaginitis (1,8%), flatulencia y (1,6%) y dolor abdominal (1,4%). En un 3,7%, el tratamiento con levofloxacina tuvo que ser abandonado debido a reacciones adversas.

**Farmacocinética:** la levofloxacina puede administrarse por vía oral, intravenosa u oftálmica. Después de su administración oral, la levofloxacina se absorbe rápidamente con una biodisponibilidad del 99%. La absorción no es afectada por los alimentos, aunque las contracciones máximas se retrasan una hora. Las concentraciones plasmáticas máximas se alcanzan entre 1 y 2 horas después de una dosis oral. Después de dosis múltiples de 500 mg/día a en una sola dosis, el estado de equilibrio ("steady state") se alcanza a las 48 hora

## CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

No se han establecido la seguridad y eficacia de la levofloxacina en niños o adolescentes de menos de dieciocho años. Las fluoroquinolonas, incluyendo la levofloxacina, inducen osteocondrosis y artropatías en los animales jóvenes de varias especies. Se desconoce hasta que punto pueden tener este efecto en el ser humano

## INTERACCIONES

Las quinolonas forman quelatos con los cationes divalentes y trivalentes. La absorción de la levofloxacina puede ser reducida de manera considerable si se administra concomitante con medicamentos que contenga sales de aluminio, calcio, magnesio, o de cinc, especialmente si la administración se hace al mismo tiempo o en un plazo inferior a 60 minutos.

# CLARITROMICINA



## DESCRIPCIÓN

La claritromicina es un antibiótico perteneciente al grupo de los macrólidos.

**Mecanismo de acción:** la claritromicina ejerce su acción antibacteriana por interferir la síntesis de proteínas en las bacterias sensibles ligándose a la subunidad 50S ribosomal. La claritromicina ha demostrado actividad in vitro frente a cepas de bacterias y frente a aislados clínicos. El espectro antibacteriano in vitro de claritromicina es el siguiente:

•Bacterias sensibles: *Streptococcus agalactiae*, *Streptococcus pyogenes*, *Streptococcus viridans*, *Streptococcus pneumoniae*, *Haemophilus influenzae*, *Haemophilus parainfluenzae*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Listeria monocytogenes*, *Pasteurella multocida*, *Legionella pneumophila*, *Mycoplasma pneumoniae*, *Helicobacter pylori*, *Campylobacter jejuni*, *Chlamydia trachomatis*, *Chlamydia pneumoniae*, *Branhamella catarrhalis*, *Bordetella pertussis*, *Borrelia burgdorferi*, *Staphylococcus aureus*, *Clostridium perfringens*, *Peptococcus niger*

**Farmacocinética:** la claritromicina se absorbe rápidamente. La biodisponibilidad absoluta de los comprimidos de 250 mg es, aproximadamente, del 50%. No existen indicios de acumulación y el metabolismo no se altera después de la administración de dosis múltiples. La presencia de alimentos en el tracto digestivo no afecta la biodisponibilidad global del fármaco, aunque puede retrasar ligeramente la absorción de éste

**Pacientes con úlcera duodenal asociada a *Helicobacter pylori*: Los tratamientos recomendados para la erradicación de *Helicobacter pylori***

**Toxicidad:** La dosis letal media de claritromicina fue mayor de 5 g/kg en estudios realizados en ratas y ratones. Los perros fueron los animales más sensibles a claritromicina, tolerando 50 mg/kg/día durante 14 días, 10 mg/kg/día durante 1 a 3 meses y 4 mg/kg/día durante 6 meses sin efectos adversos. El primer órgano dañado por las dosis tóxicas fue el hígado en todas las especies. El desarrollo de hepatotoxicidad se detectó muy pronto en todas las especies por el aumento de las concentraciones séricas de las enzimas hepáticas. La interrupción del tratamiento normalmente dio como resultado la vuelta a los valores normales. En los estudios de teratogénesis y mutagénesis no se ha observado ninguna evidencia de teratogenicidad ni potencia] mutagénico para claritromicina.

**Pacientes con infecciones producidas por micobacterias:**

**Tratamiento:** La claritromicina debe utilizarse conjuntamente con otros agentes antimicobacterianos.

**Para el tratamiento de las infecciones producidas por *Mycobacterium avium comple***

## PRESENTACION

•Bremon 250 Comprimidos, [Bremon 500 Comprimidos](#), Bremon 250 Sobres, Bremon 500 Sobres, Bremon Suspensión 125, Bremon Suspensión 250. Bremon IV: 500 mg de claritromicina. PENSA MEDICA

•Klacid, 250 comprimidos, Klacid 500 comprimidos, Klacid 250 Sobres, Klacid 500 Sobres, Klacid Suspensión 125, Klacid Suspensión 250. Klacid IV: 500 mg de claritromicina. ABBOTT

•Kofron, 250 comprimidos, Kofron 500 comprimidos, Kofron 250 Sobres, Kofron 500 Sobres, Kofron Suspensión 125, Kofron Suspensión 250. Kofron IV: 500 mg de claritromicina. GUIDOTTI FARMA

## CONTRAINDICACIONES Y ADVERTENCIAS

La claritromicina está contraindicada en enfermos con antecedentes de hipersensibilidad a los antibióticos macrólidos. La claritromicina puede ocasionar serias reacciones alérgicas incluyendo angioedema y shock anafiláctico aunque raros

## INTERACCIONES

En los estudios clínicos realizados se ha observado que hay un incremento de los niveles séricos de teofilina o carbamazepina, cuando se administran conjuntamente con claritromicina. Los pacientes que reciban estas asociaciones deberán ser sometidos a vigilancia médica y en caso necesario adecuar la dosificación. La toxicidad de la teofilina puede ser minimizada si el tratamiento con claritromicina se inicia y estabiliza antes del tratamiento teofilina

## EFFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos descritos con la administración del fármaco han sido: Náuseas, vómitos, alteración del gusto, dispepsia, dolor abdominal, dolor de cabeza, diarrea y aumento transitorio de las enzimas hepáticas. Como ocurre con otros macrólidos, se ha descrito para claritromicina la aparición poco frecuente de disfunción hepática con aumento de las enzimas hepáticas y hepatitis colestásica y/o hepatocelular con o sin ictericia. Esta disfunción hepática puede ser grave y es generalmente reversible



## DESCRIPCION

La moxifloxacina es una fluoroquinolona de amplio espectro activa por vía oral. Pertenece a un grupo de quinolonas conocidas como 8-metoxi fluoroquinolonas y es eficaz contra las bacterias gram-positivas y gram-negativas. En comparación con otras fluoroquinolonas, la moxifloxacina y otras 8-metoxi-fluoroquinolonas (por ejemplo, la gatifloxacina) tienen una actividad mejorada notablemente frente a neumococos sensibles y resistentes a la penicilina, pero una actividad ligeramente menor frente a especies de *Pseudomonas* y enterobacterias. El espectro de actividad de moxifloxacina es similar al de la trovafloxacina.

**Mecanismo de acción:** La moxifloxacina inhibe la topoisomerasa II (ADN girasa) de las bacterias, así como la topoisomerasa IV de las bacterias, enzimas esenciales para la duplicación, transcripción y reparación del ADN bacteriano. Las topoisomerasas alteran el ADN mediante la introducción de giros superhelicoidales en el ADN de doble cadena facilitando su desenrollamiento. La DNA-girasa tiene dos subunidades codificadas por el gen *gyrA* que causa roturas de la cadena en un cromosoma bacteriano y para luego cerrar de nuevo el cromosoma después del superenrollamiento.

**Toxicidad:** las quinolonas han demostrado originar artropatías en animales inmaduros. La administración de dosis orales de moxifloxacina de 30 mg/kg/día en perros durante 28 días (aproximadamente 1,5 veces la dosis humana máxima recomendada) resultó en artropatías. Por el contrario, no hubo evidencia de artropatía en monos y ratas maduros con dosis orales de hasta 135 y 500 mg/kg/día, respectivamente.

**Tratamiento de una exacerbación bacteriana aguda de bronquitis crónica** debido a *Haemophilus influenzae* (beta-lactamasa negativo), *Haemophilus influenzae* (beta-lactamasa positivo), *Haemophilus parainfluenzae*, *Klebsiella pneumoniae*, *Moraxella catarrhalis*, *Staphylococcus aureus* (MSSA), o *Streptococcus pneumoniae* (penicilina susceptible)  
Administración oral

## INTERACCIONES

La moxifloxacina se diferencia de la mayoría de las fluoroquinolonas en que no se producen interacciones farmacocinéticas significativas cuando se administra de forma concomitante con carbonato de calcio, o con la leche. Sin embargo, la absorción oral de moxifloxacina se reduce significativamente cuando se administra con productos que contienen sales de aluminio.

**Farmacocinética:** La moxifloxacina se administra por vía oral. Tras la administración oral, moxifloxacina es bien absorbida, con una biodisponibilidad absoluta de aproximadamente el 90%. Una vez en la circulación sistémica el fármaco se une a las proteínas plasmáticas en un 50%, independientemente de la concentración.

## INDICACIONES Y POSOLOGIA

Los siguientes microorganismos son considerados sensibles a la moxifloxacina in vitro y en ensayos clínicos: *Chlamydia pneumoniae*, *Haemophilus influenzae* (beta-lactamasa negativo), *Haemophilus influenzae* (beta-lactamasa positivo), *Haemophilus parainfluenzae*, *Klebsiella pneumoniae*, *Moraxella catarrhalis*, *Mycoplasma pneumoniae*, *Staphylococcus aureus* (MSSA) y *Streptococcus pneumoniae* (cepas susceptibles a la penicilina). La moxifloxacina presenta in vitro concentraciones inhibitorias mínimas (CIM) de  $\leq 2$  mg / ml contra la mayoría (90%) de los siguientes organismos: *Citrobacter freundii*, *Enterobacter cloacae*, *Escherichia coli*, *Fusobacterium sp*, *Klebsiella oxytoca*, *Legionella pneumophila*, *Peptostreptococcus sp*, *Prevotella sp*, *Proteus mirabilis*, *Streptococcus pneumoniae* (cepas penicilina-resistentes), y *Streptococcus pyogenes* (estreptococos del grupo A beta-hemolítico).

## CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

La moxifloxacina puede provocar una prolongación del intervalo QT. Debido a una insuficiente experiencia clínica, la moxifloxacina debe evitarse en pacientes con conocida prolongación del intervalo QT, hipopotasemia no corregida, y en pacientes tratados con antiarrítmicos de la clase IA (por ejemplo, quinidina, procainamida) o III (amiodarona, sotalol). No se ha estudiado el efecto de la moxifloxacina en pacientes con prolongación congénita del intervalo QT, pero es muy posible que estos individuos puedan ser más susceptibles a la prolongación del QT inducida por el fármaco. Debido a la limitada experiencia clínica, la moxifloxacina no se recomienda en pacientes con condiciones proarrítmicas condiciones (por ejemplo, hipokaliemia, bradicardia significativa, insuficiencia cardíaca congestiva, isquemia miocárdica y fibrilación auricular).



### **Modo de administración**

#### **Rosiglitazona**

Se puede tomar con o sin alimentos

### **Insuficiencia hepática**

#### **Rosiglitazona**

Contraindicado.

### **Insuficiencia renal**

#### **Rosiglitazona**

Precaución con I.R. grave (datos limitados). Mayor riesgo de edema e insuf. cardiaca con I.R. leve/moderada.

### **Efectos sobre la capacidad de conducir**

#### **Rosiglitazona**

Rosiglitazona en monoterapia no produce hipoglucemia y por lo tanto no afecta a la capacidad para conducir o utilizar máquinas. No obstante, se debe advertir al paciente de los riesgos de aparición de hipoglucemia cuando rosiglitazona se utiliza en combinación con otros antidiabéticos.

### **Indicaciones terapéuticas**

#### **Rosiglitazona**

Diabetes mellitus tipo 2 en:

Monoterapia: pacientes (particularmente con sobrepeso) sin control glucémico adecuado con dieta y ejercicio, y en los que el tto. con metformina es inadecuado por contraindicación o intolerancia.

Doble terapia oral combinado con:

- Metformina: pacientes (particularmente con sobrepeso) sin control suficiente a pesar de recibir la dosis máx. tolerada en monoterapia con metformina.

### **Advertencias y precauciones**

#### **Rosiglitazona**

I.R. grave (datos limitados), ancianos > 75 años (experiencia limitada). No hay datos en niños < 10 años, datos limitados entre 10-17 años. Riesgo de retención de líquidos dosis-dependiente e ICC. Vigilar reacciones adversas relacionadas con retención de líquidos, incluidos aumento de peso e insuf. cardiaca, en particular asociado con insulina o sulfonilurea, con riesgo de insuf. cardiaca y con reserva cardiaca reducida

### **Embarazo**

#### **Rosiglitazona**

Estudios en animales muestran toxicidad reproductiva. Atraviesa la placenta humana y se detecta en tejido fetal. No existen datos suficientes en embarazo. Riesgo potencial desconocido, no utilizar.

### **Reacciones adversas**

#### **Rosiglitazona**

Anemia; hipercolesterolemia, hipertrigliceridemia, hiperlipidemia, aumento de peso, aumento de apetito; isquemia cardiaca; estreñimiento; fracturas óseas; edema.



## DESCRIPCION

La pioglitazona es un fármaco antidiabético, activo por vía oral, de la familia de las tiozolidindionas también llamadas " sensibilizantes insulínicos". El primer fármaco de esta nueva familia fue la troglitazona, si bien este fármaco está asociado a una cierta hepatotoxicidad. Por el contrario, la pioglitazona no es hepatotóxica. La pioglitazona no guarda ningún parentesco con otros antidiabéticos orales como las biguanidas o las sulfonilureas.

**Mecanismo de acción:** la pioglitazona es un agonista potente y selectivo del receptor de la proliferación de los peroxisomas gamma activados (PPAR $\gamma$ ), receptores que regulan la transcripción de una serie de genes que responden a la insulina. Los receptores PPAR $\gamma$  se encuentran en los tejidos más importantes en los que la insulina ejerce su acción como el tejido adiposo, el músculo esquelético y el hígado.

**Toxicidad:** en los estudios de toxicidad con dosis repetidas administradas a ratones, ratas, perros y monos, se observó una expansión del volumen plasmático con hemodilución, anemia e hipertrofia cardiaca excéntrica reversible. Además, se observó aumento en los depósitos e infiltrados en grasa. Estos datos se observaron en todas estas especies, en concentraciones plasmáticas cuatro veces inferiores o iguales a la exposición clínica.

## CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Al igual que las sulfonilureas, las tiozolidindionas, incluyendo la pioglitazona, solo son activas en presencia de insulina por lo que no se deben utilizar para tratar la cetoacidosis diabética o la diabetes tipo 1

**Farmacocinética:** después de su administración oral, la pioglitazona se absorbe rápidamente: las concentraciones plasmáticas son ya detectables a los 30 min y las concentraciones plasmáticas máximas se alcanzan habitualmente a las dos horas de la administración. La farmacocinética de la pioglitazona es lineal para dosis de entre 2 mg y 60 mg

## INDICACIONES Y POSOLOGIA

**Tratamiento de la diabetes mellitus tipo 2:**  
Monoterapia conjuntamente con el ejercicio y la dieta para mejorar el control glucémico en pacientes con diabetes tipo 2:  
Administración oral

## INTERACCIONES

Los efectos hipoglucemiantes de la pioglitazona pueden ser potenciados por la administración concomitante de insulina, metformina, sulfonilureas u otros fármacos antidiabéticos. Aunque estas asociaciones pueden ser beneficiosas, también pueden provocar reacciones adversas e hipoglucemia. Se requiere un cuidadoso control glucémico en el caso de utilizarse estas combinaciones.



## DESCRIPCION

La metformina es un fármaco antidiabético utilizado en los diabéticos de tipo 2 para reducir los niveles elevados de glucosa post-prandial.

**Mecanismo de acción:** aunque el mecanismo de acción de la metformina no está completamente determinado, se cree que su principal efecto en la diabetes de tipo 2 es la disminución de la gluconeogenesis hepática. Además, la metformina mejora la utilización de la glucosa en músculo esquelético y en tejido adiposo aumentando el transporte de la glucosa en la membrana celular. Esto puede ser debido a una mejor fijación de la insulina a sus receptores ya que la metformina no es eficaz en los diabéticos en lo que no existe una cierta secreción residual de insulina. La disminución de la absorción intestinal de la glucosa sólo ha sido observada en animales.

**Farmacocinética:** la metformina se administra por vía oral. Su biodisponibilidad es del 50-60%. Después de una dosis oral de metformina (de liberación retardada) las concentraciones máximas se consiguen a las 7 horas y los niveles plasmáticos son un 20% más bajos que los objetidos después la misma dosis de fármaco no retardada

**Toxicidad:** en los estudios de toxicidad crónica en los ratones (de 91 semanas de duración) y en las ratas (104 semanas) con dosis 4 veces superiores a las utilizadas en la clínica no han observado evidencias de carcinogénesis en ambas especies. Sin embargo en las ratas hembra tratadas con 900 mg/kg/día se observó un aumento de la incidencia de pólipos benignos en el estroma uterino

### INDICACIONES Y POSOLOGÍA

#### Diabetes tipo II

Administración oral (comprimidos estándar)

•Adultos: las dosis recomendadas son de 500 mg dos veces al día. Esta dosis se puede aumentar a 1000 mg/dos veces al día.

## CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

La metformina está estrictamente contraindicada en la insuficiencia renal (el nivel de creatinina en suero debe ser normal), insuficiencia hepática o respiratoria avanzada, insuficiencia cardiaca congestiva, coronariopatías o arteriosclerosis avanzada. No se recomienda su uso en el alcoholismo u embarazo. De deberá administrar con precaución en enfermos de edad avanzada o muy debilitados o con patologías agudas que impliquen riesgos de alteración de la función renal: deshidratación (diarrea, vómitos), fiebre, estados infecciosos y/o hipotóxicos graves (choques, septicemias, infección urinaria, neumopatía)

acidosis láctica

## INTERACCIONES

La coadministración de metformina con otros antidiabéticos, en particular con insulina y sulfonilureas aumenta la actividad hipoglucémica de estos últimos en los enfermos diabéticos

## REACCIONES ADVERSAS

La metformina es bien tolerada en general. Se han descrito algunos casos de intolerancia digestiva: (náuseas, vómitos, diarrea) durante los primeros días de tratamiento, de carácter leve y que no han exigido la interrupción de la medicación.



Insulina Glargina es un análogo de insulina de larga duración de acción (casi 24 horas) y con un perfil de concentración plasmática plano, lo que permite un control adecuado de la glucemia basal a lo largo de todo el día con una sola dosis.

### **Mecanismo de acción Insulina glargina**

Regula el metabolismo de la glucosa. La insulina y sus análogos reducen los niveles de glucemia mediante la estimulación de la captación periférica de glucosa, especialmente por parte del músculo esquelético y del tejido adiposo, y mediante la inhibición de la producción hepática de glucosa. La insulina inhibe la lipólisis en el adipocito y la proteólisis, y estimula la síntesis de proteínas.

### **Reacciones adversas Insulina glargina**

Hipoglucemia; lipohipertrofia; reacciones en el punto de inyección; amiloidosis cutánea.

### **Indicaciones terapéuticas Insulina glargina**

Diabetes mellitus en adultos, adolescentes y niños  $\geq 2$  años (dosis 100 UI/ml) y a partir de 6 años (dosis 300 UI/ml). Diabetes mellitus en adultos (dosis 300 UI/ml).





## DESCRIPCION

La gliburida (también conocida como glibenclámidas) es un potente agente antidiabético, perteneciente a la segunda generación de sulfonilureas, utilizado como complemento a la dieta para reducir los niveles elevados de glucosa en sangre en los pacientes con diabetes de tipo 2. La gliburida es mg a mg unas 100 veces más potente que la tolbutamida y como dos veces más potente que la glipizida, una sulfonilurea de segunda generación. También se conoce con el nombre de glibenclámidas.

**Mecanismo de acción:** la acción hipoglucemiante de la gliburida se debe a la estimulación de las células de los islotes pancreáticos lo que ocasiona un aumento de la secreción de insulina. Las sulfonilureas se unen a los receptores de los canales potásicos ATP-dependientes, reduciendo el paso del potasio y produciendo la despolarización de la membrana

## REACCIONES ADVERSAS

La capacidad de muchos fármacos antidiabéticos orales incluyendo la gliburida de reducir eficazmente la glucosa en sangre disminuye con el tiempo. Este proceso se denomina fracaso secundario. No se conoce con exactitud el mecanismo de este proceso, pero puede ser debido a la progresión de la enfermedad o a una disminución de la respuesta al fármaco. El fracaso secundario, que sobreviene por producirse taquifilaxia, no debe ser confundida con el fracaso primario que tiene lugar cuando el fármaco no consigue reducir adecuadamente la glucosa en sangre cuando es administrado **por primera vez al pacientes**

**Farmacocinética:** la gliburida se administra oralmente y es rápida y completamente absorbida por el tracto digestivo. El comienzo del efecto hipoglucemiante se manifiesta en las dos primeras horas, alcanzándose un máximo a las 3-4 horas. Después de dosis repetidas en pacientes diabéticos, no existe una correlación entre la dosis y las concentraciones plasmáticas. La gliburida se metaboliza completamente en el hígado originando dos metabitos, que son sólo débilmente activos. Los metabitos y el fármaco sin metabolizar son eliminados por igual en la orina y en las heces. La semivida de eliminación es de 10 horas y la duración del efecto hipoglucemiante es de 24 h en pacientes con la función renal normal

## CONTRAINDICACIONES y PRECAUCIONES

La gliburida está contraindicada en pacientes con una hipersensibilidad conocida a las sulfonilureas. Se han descrito reacciones alérgicas como angioedema, artralgia, mialgia y vasculitis.

**La gliburida está indicada como tratamiento adjunto a la dieta** en la diabetes de tipo 2

Nota: algunos pacientes con diabetes de tipo 2 tratados con insulina pueden ser transferidos con éxito a la gliburida. Si las dosis de insulina son < 20 unidades/día, se debe probar una dosis inicial de gliburida de 2.5-5 mg una vez al día. En los pacientes que reciben entre 20 y 40 unidades de insulina al día, la dosis inicial debe ser de 5 mg/día de gliburida. En los pacientes tratados con > 40 unidades de insulina, se recomienda reducir al 50% la dosis de insulina e iniciar el tratamiento con una dosis de 5 mg de gliburida al día.

## INTERACCIONES

Las sulfonilureas se pueden combinar con otros antidiabéticos (por ejemplo, los inhibidores de la  $\alpha$ -glucosidasa, la metformina o la insulina) para mejorar el control de la glucemia. Aunque la combinación de un antidiabético oral con la insulina puede mejorar el control glucémico no existen estudios controlados en los que esta combinación haya sido comparada con una terapia intensiva a base de insulina