

Universidad Nacional Autónoma de México

Escuela Nacional de Estudios Profesionales ZARAGOZA



23 No 109

APLICACION CLINICA DE
FARMACOS EN ODONTOLOGIA

T E S I S
QUE PARA OBTENER EL TITULO DE:
CIRUJANO DENTISTA
P R E S E N T A:

Rosa María Nava García

MEXICO, D. F.

1982



Universidad Nacional
Autónoma de México

Dirección General de Bibliotecas de la UNAM

Biblioteca Central



UNAM – Dirección General de Bibliotecas
Tesis Digitales
Restricciones de uso

DERECHOS RESERVADOS ©
PROHIBIDA SU REPRODUCCIÓN TOTAL O PARCIAL

Todo el material contenido en esta tesis esta protegido por la Ley Federal del Derecho de Autor (LFDA) de los Estados Unidos Mexicanos (México).

El uso de imágenes, fragmentos de videos, y demás material que sea objeto de protección de los derechos de autor, será exclusivamente para fines educativos e informativos y deberá citar la fuente donde la obtuvo mencionando el autor o autores. Cualquier uso distinto como el lucro, reproducción, edición o modificación, será perseguido y sancionado por el respectivo titular de los Derechos de Autor.

INTRODUCCION**PROTOCOLO****UNIDAD I**

Diagnóstico de la situación actual	1
Estadísticas y Gráficas	3
Análisis de la situación actual	30

UNIDAD II**ANESTESICOS LOCALES**

Generalidades	32
Absorción	32
Mecanismo de acción	32
Metabolismo	33
Indicaciones	33
Contraindicaciones	33
Vías de administración	33
Efectos secundarios y toxicidad	34
Anestésicos locales más empleados	36
Lidocaína	37
Prilocaína	37
Carbocaína	37

UNIDAD III**ANTIBIOTICOS**

Penicilinas	38
-------------------	----

	<u>PAGINA</u>
Comentarios	46
Eritromicina	47
Comentarios	49
Lincomicina.....	50
Comentarios	51
Tetraciclinas	52
Comentarios	54
Penicilinas semisintéticas	56
Polimixina	58
Comentarios	58
 <u>UNIDAD IV</u>	
ANALGESICOS	
Generalidades	59
Indicaciones	60
Contraindicaciones	60
Efectos secundarios	61
Derivados salicílicos	62
Derivados pirazolonicos	63
Derivados anilínicos	66
Derivados sintéticos	66
Analgesicos narcóticos	67
Propoxifeno	68
Comentarios	69

UNIDAD V

RELAJANTES MUSCULARES

Generalidades	71
Indicaciones	71
Contraindicaciones	71
Efectos secundarios	71
Derivados del propanediol	72
Metocarbamol	73
Meprobamato	74
Carisoprodol	75
Comentarios	75

UNIDAD VI

SEDANTES

Generalidades	76
Indicaciones	78
Contraindicaciones	79
Efectos secundarios	80
Dosis y vías de administración	81
Comentarios	81
Benzodiazepinas	82
Clordiazepóxido	86
Diazepam	86
Fluracepam	87

	PAGINA
Neurolépticos	88
Hipnóticos	92
Barbitúricos	93
Comentarios	93
<u>UNIDAD VII</u>	
ANTIINFLAMATORIOS	
Generalidades	95
Indometacina	95
Comentarios	97
Ácido mefenámico	97
Ibuprofeno	97
Enzimas	98
a) Proteolíticas	98
b) Fibrinolítica	98
c) Estreptocinasa y estreptodornasa	99
Comentarios	100
RESULTADOS Y DISCUSION	101
CONCLUSIONES	101
PLANTEAMIENTO SUPERADOR	102
CUADRO BASICO DE FARMACOS	103

INTRODUCCION

La utilización de fármacos, para las diferentes afecciones de la cavidad oral, ha sido un tema muy discutido, debido a que muchos autores los recomiendan y otros los contraindican, por ejemplo: Los antibióticos como preventivos de infecciones, así como en la infección misma deben ser administrados en forma adecuada para contrarrestar el efecto de los microorganismos como agentes causales de dicha infección.

La mayoría de los odontólogos hacen uso indiscriminado de los fármacos, debido al desconocimiento de sus indicaciones y contraindicaciones y éstos también se dejan llevar por la publicidad comercial, olvidando la mayoría de las veces de hacer una revisión bibliográfica y ver si realmente los medicamentos son eficaces y eficientes, no pensando en el beneficio y costo social de estos.

Uno de los principales fármacos que más se ha utilizado en forma irracional es la Penicilina, debido a su bajo costo y a su gran efectividad en algunos padecimientos y que en muchos casos en los que no se controla su dosis provocan reacciones de hipersensibilidad, o bien, resistencia del agente causal.

Tomando en cuenta, que en la ciudad de México, es muy frecuente la automedicación, hemos decidido realizar encuestas con el personal médico odontólogo, así como, con la población para detectar los medicamentos que más se utilizan, y en que forma se administran, para así elaborar un trabajo que brinde una mejor orientación tanto a estudiantes, como a profesionales del campo odontológico, del uso adecuado de dichos fármacos.

PROTOCOLO

1.- TITULO: APLICACION CLINICA DE FARMACOS EN ODONTOLOGIA.

2.- AREA ESPECIFICA DEL PROYECTO: FARMACOLOGIA CLINICA

3.- PERSONAS QUE PARTICIPAN:

ASESOR: JESUS RIOS ESTRELLA

ALUMNOS: MENDOZA ALVARADO VICTOR MANUEL
NAVA GARCIA ROSA MARIA

4.- FUNDAMENTACION DE LA ELECCION DEL TEMA:

El motivo principal de haber escogido este tema fué por el poco conocimiento que al final de la carrera se obtuvo de la administración clínica de todos los fármacos, pretendemos que con esta tesis puedan las generaciones subsiguientes consultarla y tener un poco de conocimientos sobre farmacología clínica, muchas veces los cursos que se puedan dar de farmacología son insuficientes, no porque sean malos sino porque es poco el tiempo -- que se pueden manejar a nivel docente, no hay nada mejor que poder reforzar el conocimiento que se obtiene en clase como la consulta bibliográfica.

Como profesionistas creemos que es muy importante la medicación, ya -- que como Cirujanos Dentistas debemos conocer las indicaciones y efectos de los fármacos, en la práctica profesional nos enfrentamos con enfermedades a las cuales debemos dar tratamiento y el paciente está en nuestras manos, se trata de una vida humana con la cual no podemos equivocarnos al dar un tratamiento.

Biosocialmente al individuo le puede perjudicar la mala administración de los fármacos ya que podemos bloquear sus actividades sociales o de -- trabajo si hay efectos secundarios indeseables para el paciente, o por ejemplo psicológicamente el paciente puede estar predispuesto al dolor y -- sino se valora su padecimiento puede haber una mala administración que no era necesaria y que sin embargo, se utilizó. Esto perjudica al paciente ya que se va a sentir enfermo y siempre va a querer depender de algún medicamento. Esto mismo puede suceder con los sedantes que aún ni los médicos saben utilizar adecuadamente, se ha hecho uso indiscriminado -- de ellos, esto se ha comprobado bibliográficamente y trataremos por medio de nuestra investigación obtener resultados.

La automedicación es importante analizarla por los trastornos que en ocasiones se va a ocasionar el paciente, ya que no tiene conocimientos de -- los efectos que puede tener el medicamento que se esta tomando, y que no puede provocar las mismas reacciones en todas las personas. Los fármacos en general son de empleo delicado y deben ser recetados por el personal especializado en esta materia.

5.- PLANTEAMIENTO DEL PROBLEMA:

Los odontólogos consideran los efectos colaterales que se producen en el organismo, por la administración de fármacos de acción sistémica y local? La utilización de fármacos para las diferentes afecciones de la cavidad oral, ha sido un tema muy discutido, debido a que muchos autores los recomiendan y otros los contraindican, por ejemplo: Los antibióticos, como preventivos de infecciones, así como en la infección misma deben ser administrados en forma adecuada para contrarrestar el efecto de los microorganismos como agentes causales de dicha infección.

La mayoría de los odontólogos hace uso indiscriminado de los fármacos, - debido al desconocimiento de sus indicaciones y contraindicaciones y éstos también se dejan llevar por la publicidad comercial, olvidando la mayoría de las veces de hacer una revisión bibliográfica y ver si realmente los medicamentos son eficaces y eficientes, no pensando en el beneficio y costo social de estos.

Uno de los principales fármacos que más se ha utilizado en forma irracional es la penicilina, debido a su bajo costo y a su gran efectividad en algunos padecimientos y que en muchos casos en los que no se controla su dosis, provocan reacciones de hipersensibilidad o bien, resistencia del agente causal.

Tomando en cuenta, que en la ciudad de México, es muy frecuente la automedicación, hemos decidido realizar encuestas con el personal médico-odontólogo, así como, con la población para detectar los medicamentos -- que más se utilizan, y en que forma se administran, para así elaborar un trabajo que brinde una mejor orientación tanto a estudiantes como a profesionales del campo odontológico, del uso adecuado de dichos fármacos.

6.- OBJETIVOS:

- a) Identificar los diferentes fármacos mas usados en odontología.
- b) Describir las vías de administración de los distintos fármacos.
- c) Explicar su mecanismo de acción.
- d) Describir como saber hacer un uso racional para cada uno de los padecimientos.

7.- HIPOTESIS:

Los profesionistas en odontología, hacen uso de diversos fármacos de acción sistémica y local, sin tomar en cuenta los efectos colaterales que se van a ocasionar,

8.- MATERIAL Y METODOS:

MATERIAL.- Los medios en que se basa esta investigación es en el levantamiento de encuestas y de la investigación bibliográfica correspondiente.

METODOS.- Se realizarán 100 encuestas correspondiendo al 100% de las cuales 50% se aplicará a profesionistas y 50% a estudiantes de odontología, sin tomar en cuenta edad, sexo, años de experiencia, etc., el muestreo será tomado al azar tanto de profesionistas como de estudiantes, las preguntas serán abiertas, tomando en cuenta los siguientes fármacos: Anestésicos, antiinflamatorios, antibióticos, analgésicos, relajantes musculares y sedantes.

En las encuestas que se aplicarán se tomarán como variantes de los fármacos ya mencionados, su nombre del medicamento, el porqué de su utilización, el uso en niños y adultos y los tratamientos en que se utilizan.

Se hará una revisión bibliográfica para explicar el manejo correcto de estos medicamentos, describiendo desde el origen de su base farmacológica hasta su aplicación clínica con sus ventajas y desventajas.

También se hará un muestreo con 100 pacientes en general, sin tomar en cuenta su edad, sexo, ocupación, etc., las preguntas son abiertas. En estas encuestas se tomarán como variantes, el medicamento que toman, porqué lo toman, la dosis y frecuencia con que los toman y ver si se recetaron o si fue por iniciativa propia o por recomendación.

9.- BIBLIOGRAFIA QUE APOYA EL PROYECTO:

1º Terapéutica antimicrobiana

Carlos E. Biro.

2º The effects and significance of subminimal inhibitory concentrations of antibiotics.

Washington SA 2D

Rev Infect Dis 1979, SEP-OCT; 1 (5) 781-6

3º Anti-inflammatory agents

Antipyretic effect of acetaminophen suppositories in rats Lock A. ET.

AL- J. Pharm SCI 1979, SEP 68 (9) 1105-7

4º Antibiotics "Administration and dosage"

Drug-inactivating enzymes of bacteria grown in subminimal inhibitory concentrations of antibiotics, Grassl GG, REV.

INFECTS DIS 1979, SEP-OCT; 1 (5) 852-7

NOTA: La bibliografía será ampliada conforme a las necesidades del desarrollo,

10.- CRONOGRAMA DE ACTIVIDADES.

Tiempo para seleccionar el tema2 semanas
Tiempo para autorización del Asesor1 semana
Tiempo para autorización del tema por la sección1 semana

TOTAL 1 mes

Levantamiento del 1er. tipo de encuesta1 mes
Elaboración de protocolo1 mes
Levantamiento del 2º tipo de encuestas1 mes
Revisión del protocolo por el Asesor1 mes
Revisión del protocolo por la sección1 mes
Elaboración de tesis6 meses

TOTAL 1 año

DIAGNOSTICO DE LA SITUACION ACTUAL

Para hacer el diagnóstico de situación actual se llevarón a cabo 100 encuestas entre profesionistas y estudiantes de la Carrera de Odontología (forma 1), además de 100 que se obtuvieron de pacientes con diferentes ubicaciones en la Ciudad del Distrito Federal (forma 2).

MARCO ANTONIO PALOMINO GALIANO

INSTITUCIÓN EN LA QUE LABORA

SU ESPECIALIDAD ES

USO MAS FRECUENTE	NOMBRE	POR QUE	INDICACIONES	CONTRAINDICACIONES	EFECCIONES
ANSIOLITICOS	ALPACOSA TRICICLANA	NO CAUSAN DAÑOS	VELOCIDAD	3 CALOR	SUCESOS DE PERIAPICIA
PELAJANES	INDOLINA	NO CAUSAN DAÑOS	VELOCIDAD	3 CALOR	NO CAUSAN DAÑOS
ANTIBIOTICOS	AMOXICILINA	NO CAUSAN DAÑOS	VELOCIDAD	3 CALOR	INDICACIONES
SEDANTES	ALPACOSA	NO CAUSAN DAÑOS	VELOCIDAD	3 CALOR	INDICACIONES
ENZIMAS	TRICICLANA	NO CAUSAN DAÑOS	VELOCIDAD	3 CALOR	INDICACIONES
ANALGESICOS	INDOLINA	NO CAUSAN DAÑOS	VELOCIDAD	3 CALOR	INDICACIONES

Forma (1)

NOMBRE: María Cruz Torres
 EDAD: 30 años
 SEXO: Femenino (X) Masculino ()
 OCUPACION: Profesional
 DOMICILIO: Av. Insurgentes Sur No. 1234
 1) Que medicamento ha tomado durante el último mes?
Paracetamol
 2) Para que lo tomo?
Para el dolor
 3) Nombre del medicamento
Paracetamol
 4) Dosis
500 mg cada 6 horas
 5) Se lo recetaron (X)
 Recomendado ()
 Por iniciativa propia ()

Forma (2)

De este muestreo se pudieron obtener gráficas en donde nos muestran cuáles son los fármacos mas utilizados por el Odontólogo (profesionistas y estudiantes) según el orden que a continuación presentamos:

- 1) Anestésicos (gráfica 1)
- 2) Antibióticos (gráfica 2)
- 3) Analgésicos (gráfica 3)
- 4) Relajantes (gráfica 4)
- 5) Sedantes (gráfica 5)
- 6) Antiinflamatorios (gráfica 6)

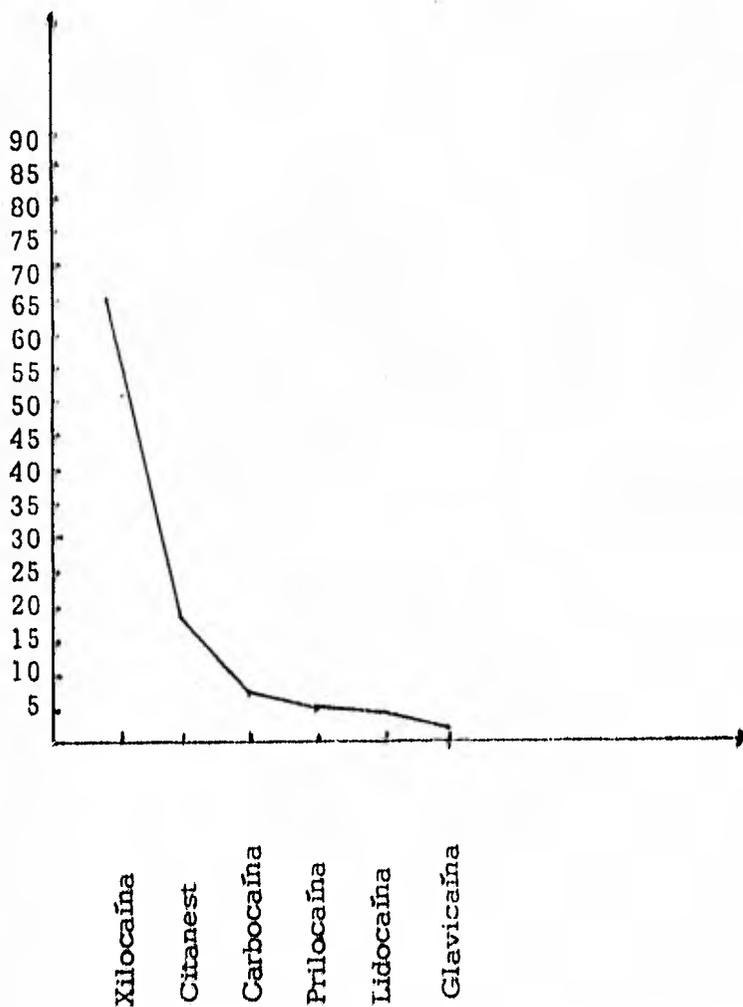
Aunque de cada uno de estos fármacos hay una gran variedad, el uso de los mismos es muy limitado por diversas razones; que se obtuvieron en las encuestas (forma 1), como son: Su rápida acción, porque se ha obtenido buen resultado en la práctica, por su efecto prolongado, por su baja toxicidad, etc.

A continuación presentamos gráficas y estadísticas de la selección que se hizo de cada uno de los fármacos.

ANESTESICOS

ESTADISTICA

Nombre	Cantidad	%
Xilocaína	65	65.7
Citanest	18	18.2
Carbocaína	7	7.1
Prilocaína	4	4.0
Lidocaína	3	3.0
Clavicaína	1	1.0
	<hr/>	<hr/>
	99	100.0



Grafica No, 1

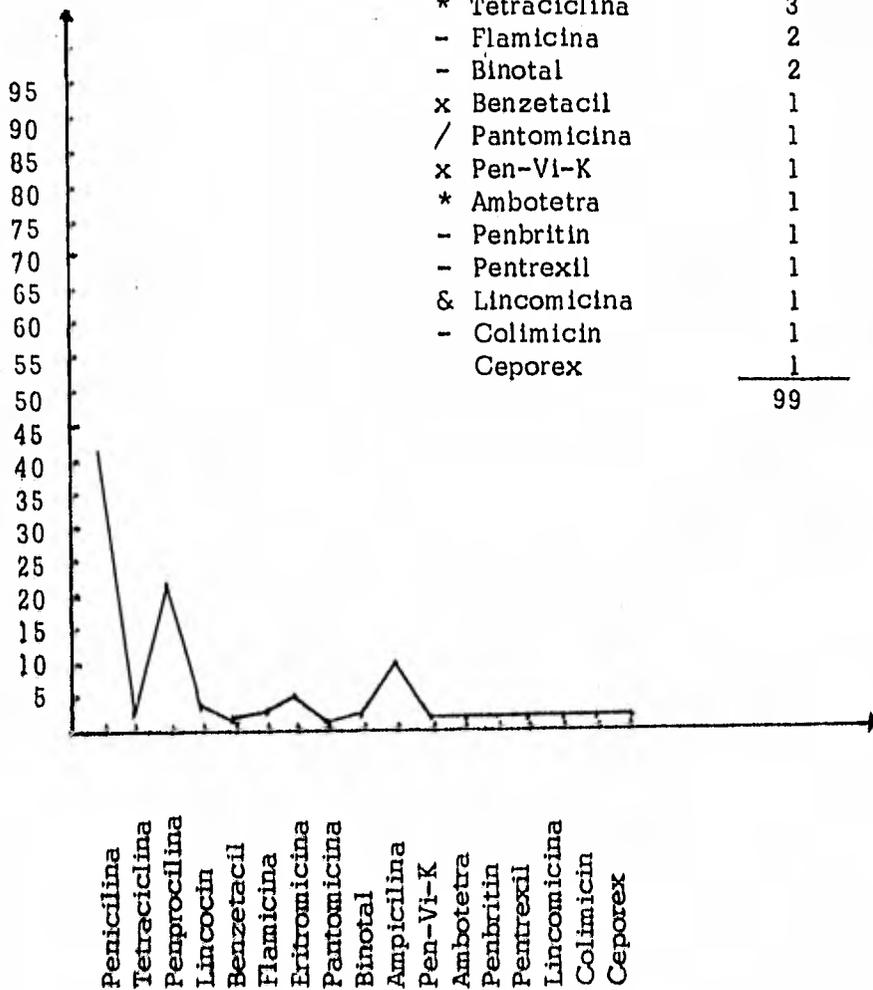
Los tres anestésicos más usados fueron:

- 1) Xilocaína representando un 65.7 %
- 2) Citanest que representa un 18.2 %
- 3) Carbocaína que representa un 7.1 %

Los demás anestésicos que se representan en la gráfica son los mismos - que los anteriores, solo que así fueron sacados de las encuestas de acuerdo a las respuestas que recibimos, ya que la Lidocaína, Glavicaína y la Xilocaína tienen la misma base farmacológica y lo único que cambia es su nombre comercial y la calidad de dicha base, la Prilocaína y el Citanest se encuentran en el mismo caso.

ANTIBIOTICOS

ESTADISTICA		
Nombre	Cantidad	%
x Pen icilina	42	42.4
x Penprocilina	21	21.2
- Ampicilina	11	11.1
/ Eritromicina	5	5.1
& Lincocin	4	4.1
* Tetraciclina	3	3.1
- Flamicina	2	2.0
- Binotal	2	2.0
x Benzetacil	1	1.0
/ Pantomicina	1	1.0
x Pen-Vi-K	1	1.0
* Ambotetra	1	1.0
- Penbritin	1	1.0
- Pentrexil	1	1.0
& Lincomicina	1	1.0
- Colimicin	1	1.0
Ceporex	1	1.0
	<hr/> 99	<hr/> 100.0



Grafica No, 2

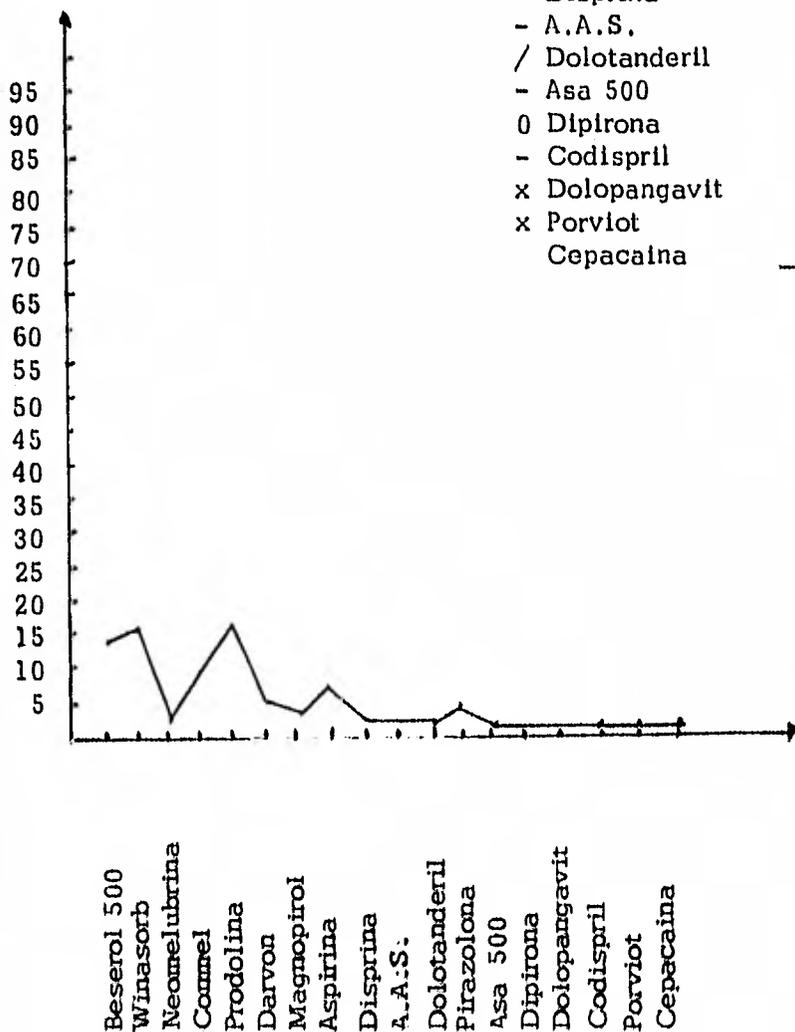
- 1) Penicilinas naturales que representan un 65.6 %
- 2) Penicilinas sintéticas que representan un 18.1 %
- 3) Lincomicina que representan un 5.1 %
- 4) Eritromicinas que representan un 6.1 %
- 5) Tetraciclinas que representan un 4.1 %
- 6) Cefalosporinas que representan un 1.0 %

Debemos hacer incapié de que para las enfermedades bucales mas frecuentes, no deben utilizarse ampicilinas y sin embargo en las encuestas estan ocupando el segundo lugar de administración, más adelante se explicará la razón de su contraindicación en boca.

ANALGESICOS

ESTADISTICA

Nombre	Cantidad	%
* Winasorb	16	16.8
x Prodolina	16	16.8
x Beserol 500	14	14.7
x Conmel	10	10.5
- Aspirina	8	8.4
& Darvon	6	6.3
x Pirazolona	5	5.3
x Magnopiroi	4	4.2
x Neomelubrina	3	3.2
- Disprina	2	2.1
- A.A.S.	2	2.1
/ Dolotanderil	2	2.1
- Asa 500	1	1.1
0 Dipirona	1	1.1
- Codispril	1	1.1
x Dolopangavit	1	1.1
x Porviot	1	1.1
Cepacaina	1	1.1
	<hr/> 95	<hr/> 100.0



Grafica No, 3

Porcentaje Global

x = 56.9 %

* = 16.8 %

- = 15.8 %

& = 6.3 %

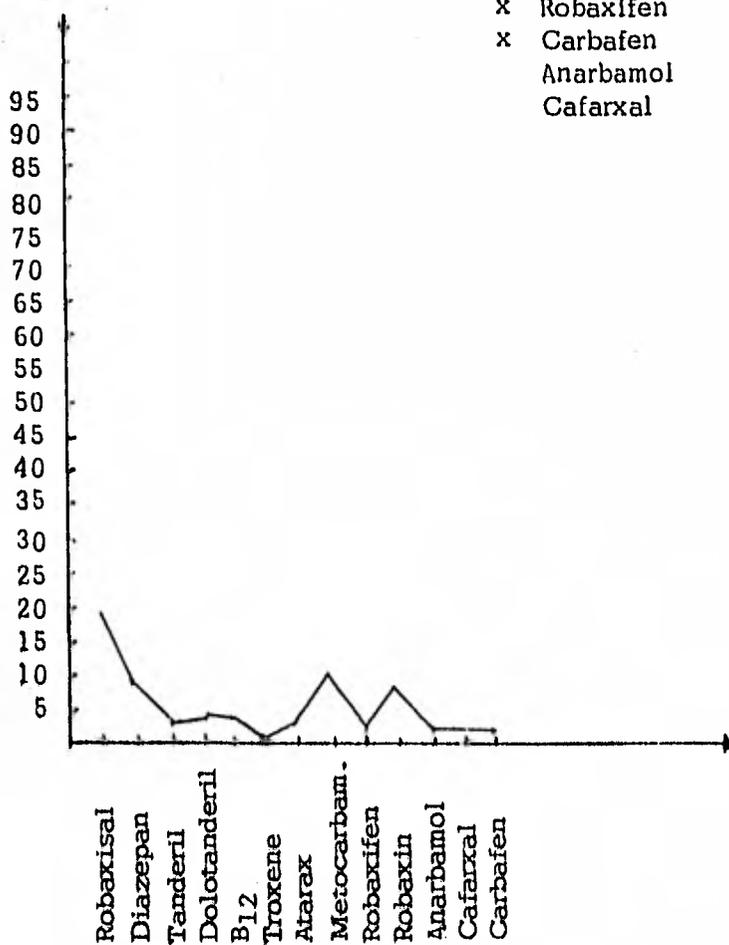
/ = 2.1 %

- 1) Pirazolonas que representan un 56.9 %
- 2) Acetaminofen que representa un 16.8 %
- 3) Acido Acétil Salicílico que representa un 15.8 %
- 4) Clorhidrato de Propoxifeno que representa 6.3 %
- 5) Oxifenbutazona que representa un 2.1 %

Encontramos que lo más utilizado como analgésico son las pirazolonas, - aunque podemos observar que todos los fármacos que se mencionaron anteriormente, los cuales fueron sacados de las encuestas, quitan el dolor en mayor o menor grado.

RELAJANTES

ESTADISTICA		
Nombre	Cantidad	%
- Robaxisal	18	31.6
x Metocarbamol	10	17.5
x Robaxin	8	14.0
* Diazepan	7	12.3
/ B ₁₂	3	5.3
& Tanderil	2	3.5
& Dolotanderil	2	3.5
* Atarax	2	3.5
* Troxene	1	1.8
x Robaxifen	1	1.8
x Carbafen	1	1.8
Anarbamol	1	1.8
Cafarxal	1	1.8
	<hr/>	<hr/>
	57	100.0



Grafica No. 4

Porcentaje Global

x = 35.1 %

- = 31.6 %

* = 17.6 %

& = 7.0 %

/ = 5.3 %

1) Metocarbamol solo representa un 35.1 %

2) Metocarbamol + Acido Acétil Salicílico que representa un 31.6 %

3) Benzodiazepina que representa un 17.6 %

4) Oxifenbutazona que representa un 7.0 %

5) Vitamina B₁₂ que representa un 5.3 %

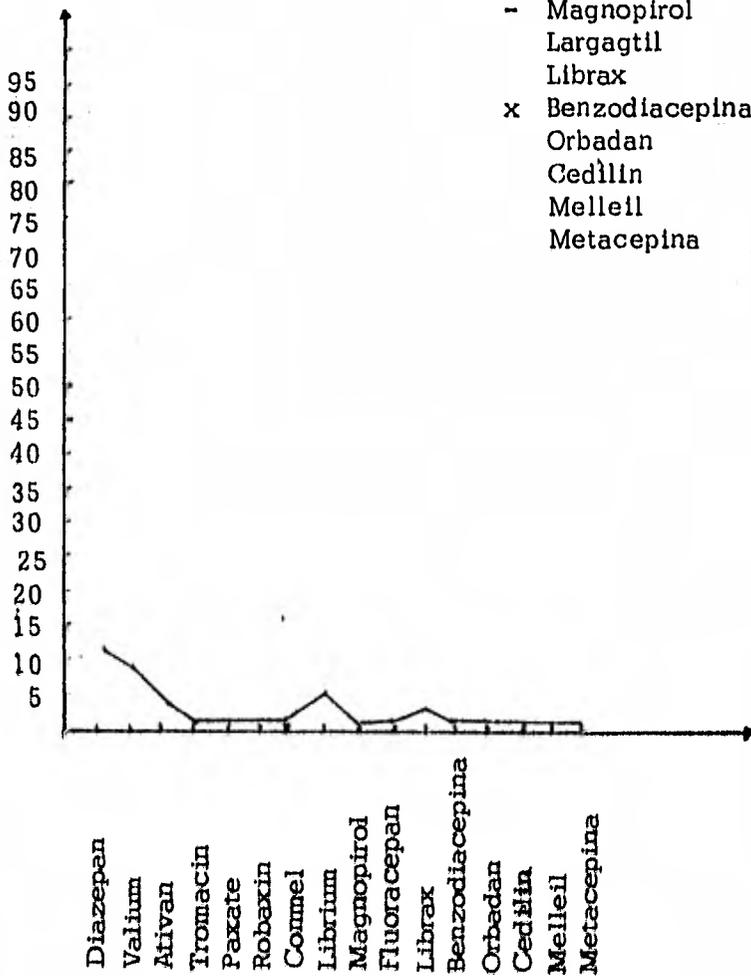
Se puede observar que la Benzodiazepina que es basicamente un sedante - también nos sirve como relajante.

La Oxifenbutazona, que es basicamente antiinflamatorio no tiene porque - usarse como relajante.

SEDANTES

ESTADISTICA

Nombre	Cantidad	%
x Diazepan	11	25.6
x Valium	9	21.0
x Librium	5	11.6
x Ativan	4	9.3
x Fluoracepan	2	4.7
Tromacin	1	2.3
x Paxate	1	2.3
0 Robaxin	1	2.3
- Conmel	1	2.3
- Magnoprol	1	2.3
Largartil	1	2.3
Librax	1	2.3
x Benzodiacepina	1	2.3
Orbadan	1	2.3
Cedilin	1	2.3
Melleil	1	2.3
Metacepina	1	2.3
	<u>43</u>	<u>100.0</u>



Gratica No. 5

Porcentaje Global

x = 76.8 %

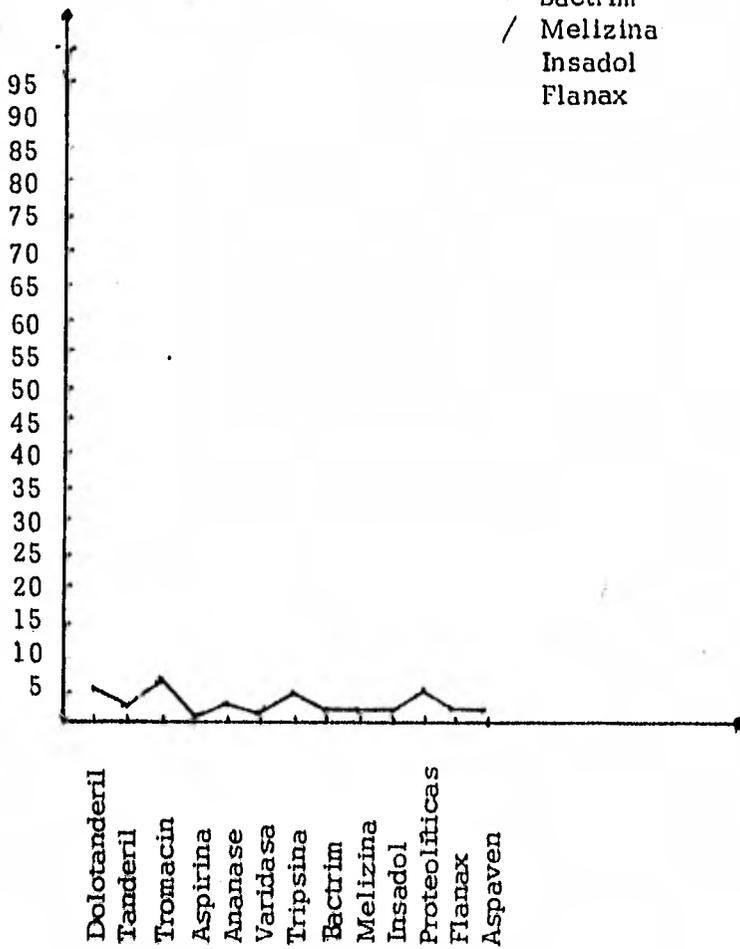
- = 4.6 %

- 1) Benzodiazepina que representa un 76.8 %
- 2) Pirazolona que representa un 4.6 %
- 3) Metocarbamol que representa un 2.3 %
- 4) Enzimas que representa un 2.3 %
- 5) Barbitúrico que representa un 2.3 %
- 6) Fenotiacina que representa un 2.3 %

Notamos que hay mucha confusión en cuanto a la utilización de sedantes, ya que no se saben administrar correctamente.

ANTIINFLAMATORIOS

ESTADISTICA		
Nombre	Cantidad	%
- Dolotanderil	4	14.3
x Tromacin	5	17.9
x Proteoliticas	4	14.3
x Tripsina	3	10.7
- Tanderil	2	7.1
x Ananase	2	7.1
Aspaven	2	7.1
0 Aspirina	1	3.6
& Varidasa	1	3.6
* Bactrim	1	3.6
/ Melizina	1	3.6
Insadol	1	3.6
Flanax	1	3.6
	<hr/>	<hr/>
	28	100.0



Grafica No, 6

Porcentaje Global

x = 50.0 %

- = 21.4 %

& = 3.6 %

- 1) Enzimas que representa un 50.0 % (Proteolítica)
- 2) Oxifenbutazona que representa un 21.4 %
- 3) Estreptocinasa-Estreptodornasa que representa un 3.6 %
(Varidasa)
- 4) Trimetoprim-Sulfametoxazol que representa un 3.6 %
(Bactrim)

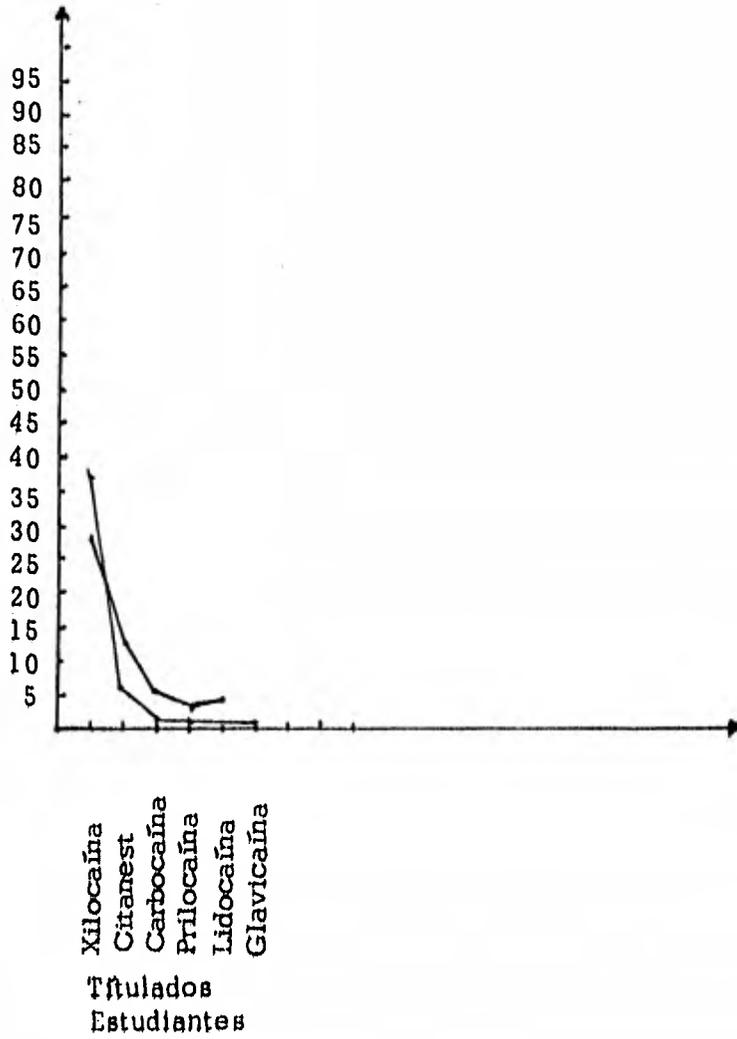
Debemos indicar que el Bactrim así como la Tetraciclina no tienen por--
que utilizarse como enzimáticos, ya que son antimicrobianos.

Las gráficas que se presentan a continuación; fueron hechas con la finalidad de comprobar el grado de conocimientos de farmacología clínica del profesionalista y del estudiante.

Nos muestran una comparación del uso que se les da a los fármacos a nivel de estudiantes y profesionalistas.

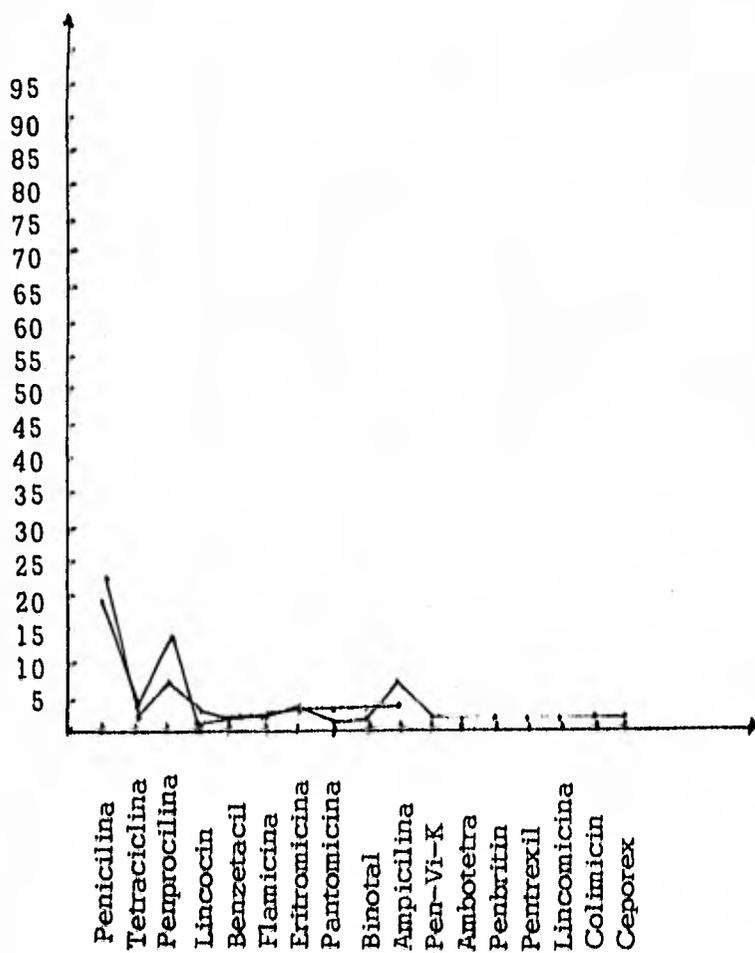
Debemos marcar que las encuestas que se obtuvieron fueron de estudiantes de ENEP Zaragoza y ENEP Aragón.

ANESTESICOS



Grafica No. 7

En esta gráfica se ve que el profesionalista, tiene más variedad de anestésicos, por poder adquirirlos, no importando su costo, ya que puede solventarlos; el estudiante se limita a utilizar los anestésicos que la clínica de la escuela le suministra.

ANTIBIOTICOS

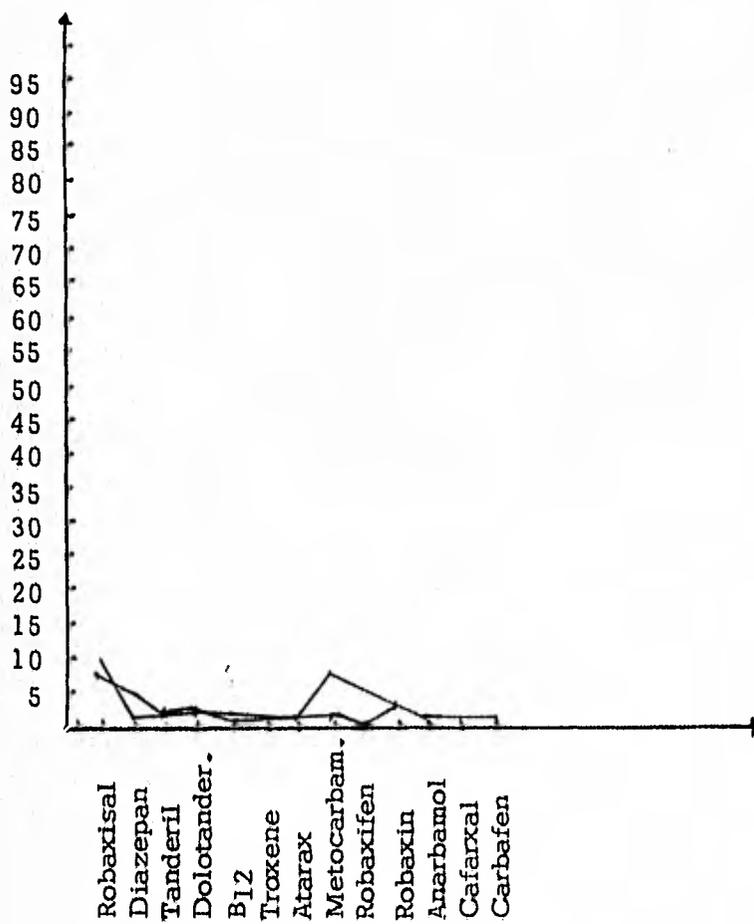
Títulados
Estudiantes

Gráfica No, 8

En esta gráfica el profesionalista tiene un cuadro más amplio para la administración de fármacos a sus pacientes aún cuando no sea el indicado, ya -- que en éstos esta influyendo la propaganda comercial de los Laboratorios.

Los estudiantes se limitan más para recetar pero el uso que le dan a los -- fármacos es más acertado y menos variado, se ve claramente que las penicilinas naturales son más utilizadas por estos. También se limitan algunas veces por falta de conocimientos de farmacología clínica.

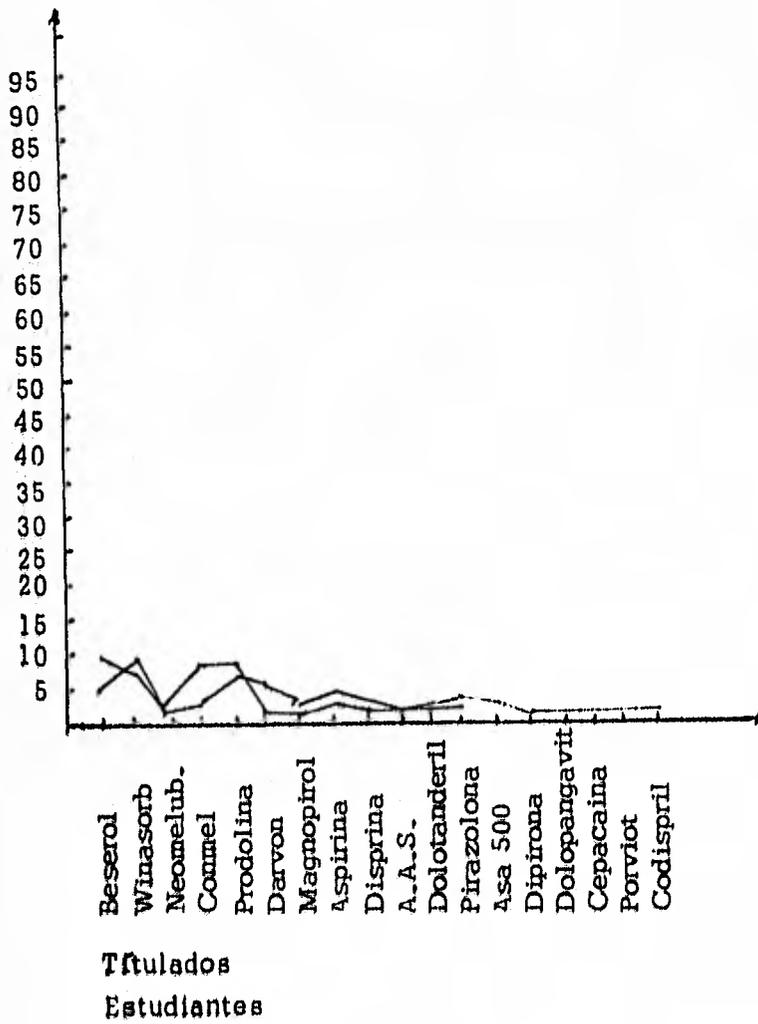
Las penicilinas sintéticas son más utilizadas por los profesionistas; siendo que como ya se menciona en páginas anteriores esta contraindicada en padecimientos más frecuentes en boca .

RELAJANTES

Ttulos
Estudiantes

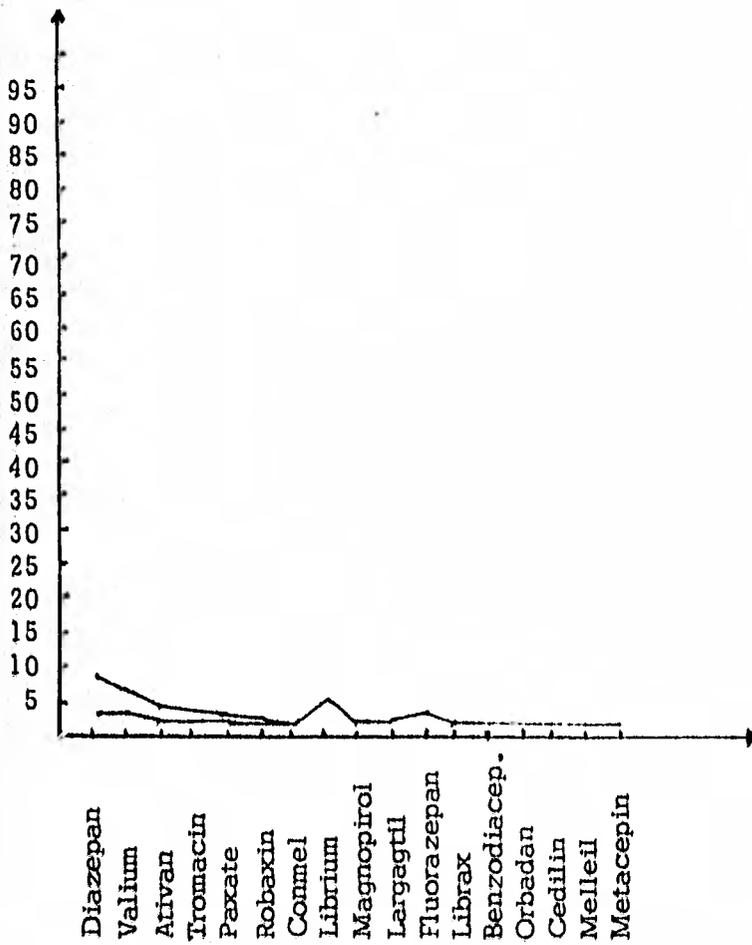
Grafica No. 9

En esta gráfica se observa que el profesionalista tiene un cuadro clínico amplio y acertado para administrar relajantes. El estudiante se limita más para recetarlos por la falta de conocimientos necesarios.

ANALGESICOS

Grafica No. 10

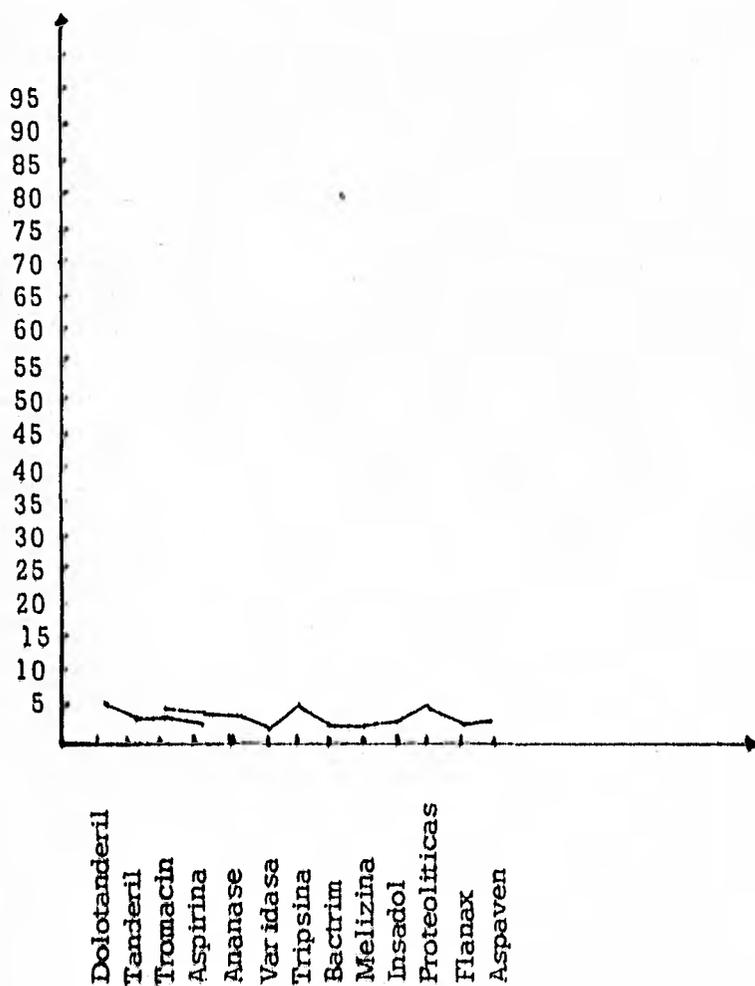
Se observa que la utilización de analgésicos es muy variado tanto por el - estudiante como por el profesionalista, debido a la publicidad comercial que muestran los Laboratorios, se puede ver que el nombre comercial es lo que los diferencia ya que se pueden considerar dentro de cinco bases farmacológicas diferentes como ya se analizó en la gráfica número 3.

SEDANTES

Titulados
Estudiantes

Gráfica No. 11

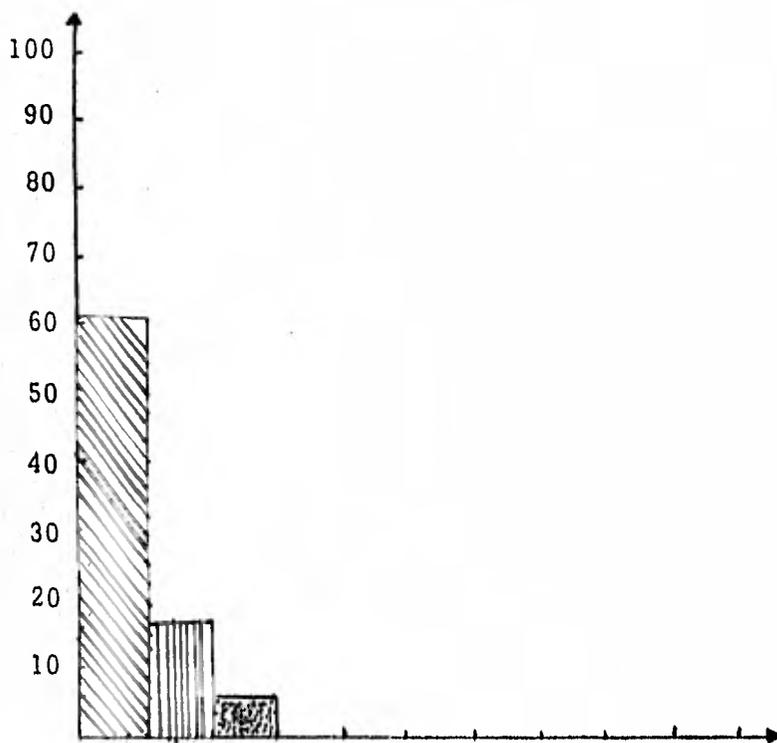
Observamos que los profesionistas tienen un cuadro clínico muy amplio - para la administración de sedantes, mientras que el estudiante tiene un cuadro clínico reducido, debido al desconocimiento de farmacología clínica, ya que muchos estudiantes se abstuvieron de contestar este inciso.

ANTIINFLAMATORIOS

Titulados
Estudiantes

Gráfica No, 12

Observamos que esta gráfica es muy reducida en cuanto a personas, ya que en las encuestas que se realizaron, la mayoría se abstuvo de contestar - el inciso que corresponde a esta pregunta, por lo tanto es de suponerse que se desconoce la utilización de las enzimas tanto por el estudiante - como por el profesionalista.



-  Recetaron
-  Iniciativa propia
-  Recomendados

Gráfica No. 13

En esta gráfica se observa un 73.5 % (61 personas), las cuales toman medicamentos recetados, un 19.3 % (16 personas), que toman medicamentos por iniciativa propia, y un 7.2 % (6 personas), que toman medicamentos por que se los recomendaron personas que no tienen los conocimientos necesarios para hacer el uso indicado de los medicamentos.

Como se observa es un porcentaje considerable el que corresponde a la administración de medicamentos mal utilizados, ya que se caé en la automedicación y no teniendo conocimientos de las contraindicaciones de los fármacos, las personas se los toman o aplican porque en otras ocasiones les han hecho efecto.

Si muchas veces los médicos deben tomar muchas precauciones y tener -
vigilancia para el enfermo, es definitivo que la automedicación es muy -
negativa para la salud de cualquier enfermo.

ANALISIS DE LA SITUACION ACTUAL

Como resultado de todas estas gráficas, se obtiene que el Cirujano Dentista y el estudiante desconocen la aplicación clínica de los fármacos; confirmando lo que se dice en la introducción. Además de que muchas encuestas las dejaron incompletas absteniéndose de contestar en algunos de los incisos que estas contienen, sobre todo los estudiantes.

Es por eso que vamos a hacer hincapié en las siguientes unidades de la aplicación clínica adecuada de los fármacos antes analizados, y proponer alternativas de solución.

En las unidades que a continuación se elaboraron, se hará la descripción de la base farmacológica, mecanismo de acción, presentación y manejo clínico de los fármacos más utilizados por los Cirujanos Dentistas; que se obtuvieron como resultado de las encuestas realizadas, tales medicamentos son: Anestésicos locales, antibióticos, analgésicos, relajantes musculares, sedantes, antiinflamatorios, utilizando una unidad para cada uno de ellos en la cual se hace una explicación concreta sobre su manejo.

UNIDAD II

ANESTESICOS LOCALES

(GENERALIDADES)

Con excepción de la cocaína, el clásico anestésico local elaborado a partir de las hojas de una planta de América del Sur, todos los anestésicos - generalmente empleados en odontología son productos sintéticos.

Químicamente se clasifican en: Anestésicos que contienen un enlace éster y anestésicos que contienen un enlace amida. Esto produce grandes diferencias farmacológicas entre los dos grupos, especialmente en el metabolismo, duración de acción y efectos secundarios.

Si consideramos la estructura química de estos compuestos, vemos que todos son aminas débilmente básicas siendo, por lo tanto, poco solubles - en el agua. Este defecto puede corregirse mediante la formación del clorhidrato.

ABSORCION

La penetración del anestésico local en los tejidos en general, y en la fibra nerviosa en particular, se debe en gran parte a la forma de base libre del compuesto. Cuando se inyecta la forma clorhidrato ésta libera la base libre al ser neutralizada por los amortiguadores tisulares.

En los tejidos infectados, la conversión del clorhidrato en base libre es - impedida por la producción ácida de los microorganismos que llega a agotar la capacidad amortiguadora de los tejidos. Este fenómeno explica en parte, la disminución de la eficacia de los anestésicos locales que, a veces, se observa en algunas áreas infectadas.

Cuando la solución anestésica local se deposita cerca de una fibra nerviosa o se infiltra en la proximidad de las terminaciones nerviosas sobre las que se desea que actúe, el fármaco no sólo se difunde hacia dichas áreas, sino que se propaga también en otras direcciones. La corriente sanguínea de los capilares, arterias y venas adyacentes acelera la eliminación del anestésico que pasa por dichos vasos. Si el anestésico es de tipo éster, las esterases contenidas en la sangre ayudan también a la descomposición de estos anestésicos locales. Por esta razón se añaden a las soluciones anestésicas locales sustancias vasoconstrictoras como epinefrina (adrenalina), levarterenol (levophed), fenilefrina (neosinefrina) y nordefrina (cobefrín) en concentraciones suficientes para producir una vasoconstricción.

MECANISMO DE ACCION

El anestésico local disminuye la conducción a lo largo del nervio, de los impulsos producidos por estímulos dolorosos, según sea el tipo y tamaño de las fibras nerviosas afectadas, se observará también una disminución

en la conducción de otros tipos de impulsos.

La propagación de los impulsos a lo largo de la axona implica una despolarización temporal de su membrana polarizada. Utilizando técnicas adecuadas, se puede emplear el fenómeno eléctrico de potencial de acción como indicador tanto de la ocurrencia como de la extensión de dicha despolarización.

Los anestésicos locales ejercen distintos efectos progresivos sobre la conducción de los impulsos en las fibras nerviosas. Los cambios más importantes observados son los siguientes: aumento del umbral necesario para producir la excitación; disminución progresiva en la amplitud del potencial de acción y moderación de la velocidad de conducción hasta el cese total de la propagación de los impulsos.

METABOLISMO

Las esterasas atacan a los fármacos de tipo éster en la sangre y en el hígado hidrolizándolos en sus componentes; ácidos benzoicos y alcohol.

Cuando las dosis son pequeñas o moderadas, la hidrólisis del anestésico local se efectúa en la sangre antes de llegar al hígado; si las dosis son grandes las esterasas hepáticas desempeñan también un papel importante. Sin embargo, las enfermedades hepáticas no suelen alterar de manera notable el metabolismo de los anestésicos de tipo éster. Los productos de la hidrólisis formados en la sangre y en el hígado, son excretados en la orina, ya sea inalterados o después de haber sido sometidos, en el hígado a procesos de oxidación y conjugación.

El metabolismo de los compuestos de tipo amida es algo más variable y complejo que el de los de tipo éster. La hidrólisis del tipo amida no se lleva a cabo en la sangre. No obstante en algunos casos la hidrólisis puede ser catalizada por una enzima en el hígado o quizá también en otros tejidos.

INDICACIONES

- 1) Anestesia de infiltración y bloqueo
- 2) Anestesia de superficie
- 3) Anestesia raquídea (subaracnoidea o intratecal)
- 4) Anestesia epidural y caudal
- 5) Anestesia intravenosa

CONTRAINDICACIONES

Con los efectos secundarios que se explicaran en breve, nos daremos cuenta de cuando esta contraindicado utilizar anestésicos.

VIAS DE ADMINISTRACION

Los anestésicos locales pueden administrarse por aplicación tópica, por -

infiltración de los tejidos con el fin de bañar las fibras nerviosas delgadas, por inyección cerca de los nervios y sus ramas, o por inyección en los espacios epidural o subaracnoideo. En ocasiones se utilizan inyecciones intravenosas para dominar algunas situaciones dolorosas.

EFFECTOS SECUNDARIOS Y TOXICIDAD

Algunos enfermos son alérgicos a los anestésicos locales. El estado alérgico aparece más fácilmente después de las aplicaciones tópicas hechas durante cierto tiempo. Aunque puede manifestarse también después de una sola inyección. La administración ulterior del anestésico puede suscitar reacciones alérgicas de distintas formas; desde las reacciones cutáneas de tipo acemátosos o urticario hasta el ataque de asma o el choque anafiláctico, la más grave de todas las reacciones. La dermatitis de contacto puede llegar a ser un verdadero problema para el odontólogo, ya que sus manos quedan expuestas a la acción de los anestésicos locales durante todo el tiempo.

Normalmente un enfermo con antecedentes de respuestas alérgicas a anestésicos locales de tipo ácido paraminobenzolico no presentará reacciones alérgicas con preparados de tipo amida. Las reacciones alérgicas leves, como las cutáneas, suelen ceder a un tratamiento con antihistaminicos. Las reacciones más graves plantean problemas serios, aunque generalmente, los broncodilatadores como la aminofilina o la epinefrina alivian rápidamente el ataque de asma, y el choque anafiláctico suele responder favorablemente a medicamentos vasoconstrictores administrados por vía intravenosa. El principio de los síntomas tóxicos es variable, pudiendo ser repentino en algunos pacientes y lento en otros.

En la mayoría de los casos se observa un efecto de estimulación sobre el sistema nervioso central, especialmente cuando se emplean compuestos de tipo éster. La acción estimulante se manifiesta por síntomas de inquietud, aprensión, temblores y en los casos más graves por convulsiones. Generalmente estos síntomas son transitorios y no ameritan tratamiento especial; únicamente se recomienda tener todo preparado en previsión de una posible depresión respiratoria. En caso de estimulación excesiva e inclusive si aparecen convulsiones graves en un enfermo que no fuera premeditado, la administración por vía intravenosa de un barbitúrico de acción ultrarrápida, como el metohexital (brevital) es un tratamiento calmante excelente. Sin embargo no está exento de peligros puesto que el barbitúrico depresor respiratorio puede aumentar todavía más la depresión respiratoria provocada por cualquier anestésico local. Por esta razón es recomendable usar barbitúricos de corta acción, si es que se llega a usarlos, para controlar los síntomas de excitación cuando éstos aparecen. Los compuestos de tipo amida, especialmente la lidocaína y, a veces, algunos anestésicos de tipo éster, producen generalmente una depresión del sistema nervioso central, que suele manifestarse por síntomas de somnolencia, torpeza e incoherencia y que puede evolucionar en algunos casos hasta el coma. En unas cuantas veces estos síntomas pueden estar precedidos por signos de excitación. La forma más grave de depresión del sis-

tema nervioso central, puede manifestarse de haberse presentado intensa estimulación o depresión. La respiración artificial si es posible con oxígeno a presión, es el tratamiento indicado y obvio. Como la respiración depresiva, es la causa más frecuente de muerte debido a la toxicidad del anestésico local, el procedimiento ya descrito puede salvar la vida del paciente y es, por lo tanto, mucho más importante que todas las tentativas realizadas para controlar las convulsiones. Por lo general no es necesario mantener la respiración artificial durante largo tiempo puesto que los anestésicos locales se metabolizan con bastante rapidez y su efecto se agota, lo cual permite al enfermo reanudar la respiración espontánea.

Los efectos tóxicos de los anestésicos locales afectan también al corazón puesto que éste contiene un tejido conductor análogo al de los nervios. Estos efectos, que suelen ser resultado de dosis excesivas, pueden también manifestarse con dosis normales en pacientes muy sensibles.

Algunos de los anestésicos locales son vasodilatadores débiles y esto -- contribuye también a la disminución de la presión arterial. La administración de oxígeno y de medicamentos vasoconstrictores ayuda a vencer las formas más leves de toxicidad cardiovascular. En este caso, la epinefrina o algún otro vasoconstrictor, que suelen contener las soluciones anestésicas, son de cierta utilidad.

Además de esta toxicidad general existe también el problema de la toxicidad local, o sea, la citotoxicidad y la aparición de reacciones tisulares locales, éstas últimas se manifiestan ya sea por eritema, edema, induración o necrosis en el sitio de inyección. Por lo general estos efectos no son atribuibles a los anestésicos locales siempre y cuando éstos se administren en las cantidades y a las concentraciones indicadas.

Reacciones Psíquicas.- La mayoría de los enfermos manifiestan reacciones psíquicas, pero, generalmente el dentista se percata sólo de aquellos signos que preceden inmediatamente al síncope. Afortunadamente las técnicas de los primeros auxilios son conocidas de todo el mundo y el poder de recuperación del organismo es tal que sólo raramente aparecerá un estado de choque. El síncope puede llevar a un estado de choque irreversible si no es tratado con la debida rapidez; toda esta evolución se desarrolla, -- por lo general, en el consultorio del dentista.

Hepatitis sérica.- La frecuencia de la hepatitis sérica va aumentando rápidamente. La enfermedad es transmitida únicamente por la introducción parenteral del virus, se han encontrado casos comprobados; consecutivos al empleo de agujas y jeringas no esterilizadas.

A continuación mostramos cuadro de anestésicos, y de acuerdo a las encuestas, hacemos una gerarquización de los anestésicos más usados, y a la estructura química que corresponde.

Por tal motivo nos enfocaremos a hablar del grupo amida ya que por medio de la gráfica 1 vemos que todos los anestésicos que aparecen son del grupo Amida.

ANESTESICOS LOCALES MAS EMPLEADOS

N O M B R E		ESTRUCTURA QUIMICA
<u>OFICIAL</u>	<u>COMERCIAL</u>	
PROCAINA	NOVOCAINA	ESTER *
BUTETAMINA	MONOCAINA	ESTER *
TETRACAINA	PANTOCAINA	ESTER *
PROPOXICAINA	ROVOCAINA	ESTER *
BENZOCAINA		ESTER *
METABUTETAMINA	UNACAINA	ESTER **
METABUTOXICAINA	PRIMACAINA	ESTER **
MEPRILCAINA	OROCAINA	ESTER ***
ISOBUCAINA	KINCAINA	ESTER ***
LIDOCAINA	XILOCAINA	AMIDA
MEPIVICAINA	CARBOCAINA	AMIDA
PIRROCAINA	DINACAINA	AMIDA
PRILOCAINA	CITANEST	AMIDA

* PABA = DERIVADO DEL ACIDO P-AMINOBENZOICO

** MABA = DERIVADO DEL ACIDO M-AMINOBENZOICO

*** BA = DERIVADO DEL ACIDO BENZOICO

LIDOCAINA

La lidocaína, introducida en 1948, es uno de los anestésicos locales de uso amplio.

La lidocaína produce anestesia más rápida, intensa, duradera y extensa que una concentración igual de procaína.

Se absorbe con relativa rapidez después de la administración parenteral y por el aparato digestivo. Aunque es eficaz cuando se utiliza sin vasoconstrictor alguno, en presencia de adrenalina la velocidad de absorción y la toxicidad disminuyen y aumenta la duración de la acción. La lidocaína es metabolizada en el hígado por oxidasas microsómicas de función mixta por desalquilación.

La lidocaína tiene aproximadamente la misma toxicidad que la procaína cuando se administra por vía subcutánea en solución al 0.5 %. Al inyectar soluciones más concentradas (2 %) la lidocaína es más tóxica que la procaína. No es irritante y es muy estable. A causa de ser metabolizada en el hígado, la Lidocaína parece ser más tóxica en individuos con trastornos de la función hepática. Un efecto secundario notable de la lidocaína es la somnolencia.

Preparados. El clorhidrato de lidocaína (Xylocaine), es un polvo inodoro, blanco y cristalino muy soluble en agua y alcohol. Los preparados oficiales son inyección y jalea.

Los preparados comerciales (0.5 a 4 %), que se obtienen en ampolletas, frascos ampula o jeringas preparadas llenas, con adrenalina y sin ella (1:100 000 a 1:200 000), son adecuados para infiltración (0.5 %), bloqueo (1 a 2 %) y anestesia tópica de las mucosas (1 % a 2 %). También se dispone de pomada de lidocaína, (2 %), y aerosol de lidocaína, N.F. (100 mg/1g).

PRILOCAINA

Clorhidrato de prilocaína (Citanest), es un anestésico local del tipo amida. Sus propiedades farmacológicas son semejantes a las de la lidocaína. El comienzo y la duración de la acción son más duraderos que los de la lidocaína. Como la lidocaína, puede producir somnolencia. Se ha empleado anestesia por infiltración, anestesia regional por bloqueo y anestesia raquídea. Se expende en soluciones de 1.0, 2.0, 3.0 y 4.0 por 100 para inyecciones.

CARBOCAINA

Clorhidrato de mepivacaína, (Carbocaine), es un anestésico local del tipo de amida introducido recientemente en la medicina. Sus propiedades farmacológicas son algo semejantes a las de la lidocaína, a la que se parece por su estructura química. Su acción tiene un comienzo más rápido y dura un poco más que la de la lidocaína. Se ha empleado para anestesia regional por bloqueo nervioso y anestesia raquídea. El clorhidrato de mepivacaína se expende en soluciones inyectables (1.0, 1.5, 2.0 y 3 % sin levonordefrina, y 2 % con ella).

BIBLIOGRAFIA

- 1) DRILL, VICTOR A.
FARMACOLOGIA MEDICA
PRIMERA EDICION, 1974
EDITORIAL PRENSA MEDICA MEXICANA
- 2) GOODMAN, LOUIS S.
GILMAN, ALFRED
BASES FARMACOLOGICAS DE LA TERAPEUTICA
QUINTA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 3) GOTH, ANDRES
FARMACOLOGIA MEDICA
OCTAVA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 4) MEYERS, FREDERIK H.
MANUAL DE FARMACOLOGIA CLINICA
TERCERA EDICION 1977
EDITORIAL EL MANUAL MODERNO
- 5) SECRETARIA DE SALUBRIDAD Y ASISTENCIA
CUADRO BASICO DE MEDICAMENTOS DEL SECTOR
PUBLICO
MEXICO 1979
- 6) JORGENSEN NIELS BJORN
ANESTESIA BUCAL
SEXTA EDICION
EDITORIAL INTERAMERICANA

UNIDAD III

ANTIBIOTICOS

De acuerdo a las encuestas realizadas; este capítulo se enfocará a los - antibióticos más utilizados, qué tipo de estructura tienen y a que grupo - pertenecen.

PENICILINAS

Generalidades

Las penicilinas comprenden un gran grupo de sustancias, siendo algunas - de ellas productos naturales de hongos y otras compuestos semisintéticos. Ellas comparten un núcleo químico común, el ácido 6-aminopenicilánico, - y un modo común de acción antibacteriana la inhibición de la síntesis -- del mucopéptido de la pared celular.

En 1928, Sir Alexander Fleming descubrió que se había producido una zona libre de bacterias en torno a un moho que había contaminado un cultivo de estafilococos, preparó un extracto del moho confirmando su primera obser- vación de que destrufa, selectivamente, algunas especies bacterianas sin afectar a los leucocitos. Debido a que el moho contaminante pertenecía - al género penicillium, Fleming denominó penicilina a la sustancia anti- - bacteriana,

En la actualidad se conocen las fórmulas químicas de las penicilinas. To- das se expenden en forma cristalina y constan, en esencia, de dos partes. El núcleo formado por el ácido 6-aminopenicilánico (6-APA) resulta de la unión de un anillo tiazolidínico con un anillo beta-lactama, más un grupo amino, un carboxilo y dos grupos metilo. Las cadenas laterales son grupos acílicos unidos gracias a un enlace amínico al 6-APA. Estas partes de la molécula determinan la absorción, estabilidad y la actividad antibacteria- na. Ni el 6-APA, ni el grupo amino poseen por sí solos actividad antibac- - teriana,

La primera penicilina semisintética que fue sometida a pruebas clínicas e introducida en el comercio fue la fenoxietilpenicilina (feneticilina). Esta sustancia tiene una relación muy estrecha con la fenoximetilpenicilina -- (penicilina V) y se absorbe con mayor facilidad aunque es menos eficaz - que la penicilina V. En 1960 se logró obtener la meticilina que es la pri- mera penicilina resistente a la penicilinasas, cosa que significó un impor- tante progreso en este campo,

Desde luego, toda la actividad antibacteriana se pierde cuando se rompe el anillo beta-lactama. La mayoría de las enzimas bacterianas, las deno- minadas penicilinasas, son realmente beta-lactamasas. Estas enzimas - hidrolizan el anillo, el que se vuelve inactivo sobre los microbios.

Recientemente se sintetizó la ampicilina, penicilina que tiene mayor acti- vidad antigramnegativa que cualquiera de las anteriores,

Propiedades Físicas.- Todas las penicilinas de que se dispone para uso clínico, excepto la ampicilina, se administran como sales sódicas o potásicas solubles en agua, se dispone también de la penicilina G en forma de dos sales relativamente insolubles, la de procaína y la N,N¹-dibencililetile nodiamina (conocida como penicilina benzatínica).

Las preparaciones secas de penicilina son muy estables a la temperatura ambiente y la penicilina G cristalina resiste una temperatura de 100°C por más de cuatro días. Sin embargo, las soluciones acuosas son relativamente inestables. La meticilina es muy inestable en soluciones aún ligeramente ácidas. Todas las penicilinas se conjugan con las proteínas séricas, siendo la oxacilina la que más firmemente se une a la proteína y la ampicilina la que menos.

Estandarización.- La unidad internacional para la penicilina G es la unidad Oxford, equivalente a 0,6 Mg (microgramo). De esta manera 1 mg equivale 1667 unidades. Las preparaciones comerciales de penicilina cristalina deben tener una potencia de por lo menos 15 000 unidades por mg.

Todas las penicilinas son manufacturadas, etiquetadas y recetadas sobre la base de su peso y no de unidades.

Indicaciones.

Las penicilinas son, con mucho los antibióticos más efectivos y los más extensamente usados. En un principio se consideraron las bacterias como sensibles a la penicilina o resistentes a la penicilina, pero realmente una amplia variedad de bacterias muestran diversos grados de sensibilidad a la penicilina y varias infecciones causadas por bacterias moderadamente resistentes a este antibiótico pueden ser tratadas con éxito empleando dosis elevadas.

La mayor parte de las penicilinas se distribuyen como la sal sódica o potásica del ácido libre. La penicilina G potásica contiene casi 1,7 mEq de K por millón de unidades de penicilina (2,8mEq/g).

Las sales de procaína (penicilina procaína) y las sales de benzatina (benzatinpenicilina) se emplean para proporcionar formas repositarias para inyección intramuscular. En forma cristalina, las sales de penicilina son estables por largos períodos (por ejemplo, durante años a 4 °C). Las soluciones pierden su actividad rápidamente (por ejemplo, en 24 horas a 20 °C) y se deben usar preparadas inmediatamente antes de administrarlas. Las penicilinas orales deben darse alejadas de las comidas una hora antes o una o dos después.

Contraindicaciones.

Después de administración parenteral, la absorción de la mayoría de las penicilinas es completa y rápida. A causa de la irritación y del consiguiente dolor local producido por la inyección intramuscular de grandes dosis, a menudo se prefiere la administración por vía intravenosa (infusión continua o adición intermitente a una venoclisis continua). Después de administración oral sólo se absorbe una porción de la dosis. Grandes dosis de peni-

cilinas dadas oralmente pueden producir trastornos gastrointestinales, particularmente náusea, vómito, y diarrea. La terapéutica oral también se puede acompañar de sobrecrecimiento exuberante de estafilococos, pseudomonas, proteus o levaduras, que ocasionalmente pueden causar enteritis. — Pueden ocurrir sobreinfecciones en otros sistemas orgánicos con las penicilinas como con cualquiera antibioticoterapia.

Una porción significativa de la población de muchos países (5 a 10%) se ha vuelto hipersensible al medicamento. En muchas ocasiones no hay duda de que la sensibilización ha ocurrido cuando la penicilina fue administrada -- sin indicación apropiada.

Efectos Secundarios.

Las penicilinas poseen indudablemente menor toxicidad directa que cualesquiera otros antibióticos. La mayor parte de los efectos colaterales serios se deben a la hipersensibilidad.

El único verdadero problema con la penicilina es el riesgo de reacciones alérgicas. La frecuencia de estas reacciones ha sido estimada en proporciones variadas, siendo alrededor de 1% después de la administración oral, 1 a 2 % después de la administración parenteral de penicilina G, 2 a 5 % después de la administración de penicilina G procaína y 5 a 10% después de la administración parenteral de penicilina benzatina.

Las reacciones más comunes son el prurito y la urticaria localizada o generalizada, que pueden aparecer en cualquier momento de la terapéutica penicilínica o aún 1 a 2 semanas después de haber suspendido la medicación. Si la reacción es leve puede controlarse con antihistamínicos y continuar el tratamiento.

El mayor riesgo de las reacciones urticarianas es el edema laríngeo; y el de otras reacciones cutáneas es la posibilidad de exfoliación generalizada. Por lo tanto, a menos que una urgente indicación clínica lo requiera, se debe suspender la medicación cuando las reacciones se hacen manifiestas o, no iniciar el tratamiento con penicilina cuando hay antecedentes muy sugestivos de intolerancia a la penicilina.

Las reacciones más temidas y más graves son las anafilácticas. En la actualidad, la penicilina es la causa más común de choque anafiláctico. Esta reacción casi siempre se produce en un individuo que tiene exposiciones previas a la penicilina y alguna vez ha presentado una reacción secundaria a ella. La reacción anafiláctica se presenta con mayor frecuencia después de la administración parenteral de penicilina, aunque puede hacerlo después de la administración oral, en cuyo caso el porcentaje de mortalidad baja. Por el momento, la alergia a una penicilina debe hacer pensar en alergia a todas las penicilinas, tomando en cuenta la posibilidad de los errores de interpretación indicados:

1. Inseguridad de si la reacción previa se debió realmente a la penicilina,
2. Edad promedio de las poblaciones de pacientes,
3. Tiempo promedio transcurrido desde la presentación de la reacción inicial,
4. Cantidades y tipos de penicilina que se utilizan,
5. Variaciones en la rutina de las pruebas cutáneas,

En estas circunstancias no se debe administrar ninguna de las penicilinas - si no hay indicación específica. Sin embargo, cuando la indicación exista, la primera dosis debe ser administrada por vía oral en condiciones bien controladas y teniendo un equipo de urgencia equipado.

Toxicidad.

Fuera de la hipersensibilidad alérgica casi es desconocida la toxicidad a las penicilinas. La penicilina G se ha usado en dosis clínicas de 100 millones de unidades diarias y la meticilina en dosis de 30 g diarios, sin efectos tóxicos.

A pesar de no poder considerarse una reacción tóxica verdadera, siempre debe tenerse en cuenta la posibilidad del superdesarrollo de los gérmenes penicilino-resistentes de la microflora normal y el aumento de la susceptibilidad a la invasión de cepas de microorganismos resistentes de origen exógeno.

El dolor en el sitio de la inyección es común a todas las penicilinas, en especial a la penicilina G. El riesgo de tromboflebitis en la zona de una infusión intravenosa permanente puede disminuirse manteniendo el pH de las soluciones entre 7.2 y 7.4 evitando los tubos de caucho, usando agujas pequeñas y fijadas con cuidado; y cambiando los sitios de infusión cada 24 a 48 horas.

La penicilina aplicada directamente es irritante para los tejidos y en especial para el sistema nervioso central. En ocasiones la aplicación directa de penicilina a la corteza cerebral humana o la instalación intraventricular provocan anomalías electroencefalográficas y convulsiones. La administración a pacientes urémicos sin tener en cuenta la acumulación que puede producirse en estas condiciones, puede producir aumento de la irritabilidad neuromuscular y convulsiones. También puede producirse intoxicación cálcica en pacientes urémicos que reciben dosis altas de penicilina sódica o potásica. Una dosis de 20 000 000 de penicilina G potásica contiene - 33 mEq (1300 mg) de potasio y 4 g de meticilina contienen 10 mEq (230 mg) de sodio.

La lesión accidental de un nervio durante la inyección puede ser seguida por neuropatía local. La introducción accidental de penicilina procaina en una vena puede producir parestesia circunmoral o generalizada y aún convulsiones. La administración prolongada de meticilina en ocasiones va seguida por neutropenia, disminución de los eritrocitos y elevadas concentraciones séricas de hierro.

Todos los casos han sido reversibles después de la suspensión de la medicación.

La administración de cualquiera de las penicilinas orales va seguida, en muchos casos, de aumento de la frecuencia de las deposiciones con emisión de heces espumosas y blandas. También puede producirse náusea, prostración, vómito y prurito anal y vulvar. Puede presentarse el superdesarrollo de levaduras y mohos junto con glositis, lengua negra pilosa e inflamación de la mucosa oral, rectal y vaginal.

Dosis.

Formas especiales de dosificación de la penicilina han sido elaboradas para absorción retardada con objeto de obtener niveles sanguíneos y tisulares bajos durante largos períodos. El ejemplo sobresaliente es la benzatín penicilina G. Después de una sola inyección intramuscular de 1.5 g (2.4 millones de unidades), los niveles séricos en exceso de 0.03 unidad/ml se mantienen durante 10 días y los niveles en exceso de 0.005 unidad/ml por tres semanas. Los últimos son suficientes para proteger contra la infección por estreptococos B-hemolítico; los primeros para tratar una infección ya establecida de estos organismos. La penicilina procaína también tiene una absorción retardada produciendo niveles durante 24 horas.

La penicilina G es el medicamento de elección para las infecciones causadas por gonococos, neumococos, estreptococos, meningococos, estafilococos que no producen B-lactamasa, Treponema pallidum y muchas otras espiroquetas, Bacillus anthracis y otros bacilos grampositivos, clostridia, listeria, bacteroides y estreptobacilos.

La mayor parte de estas infecciones responden a dosis diarias de penicilina G de 0.6-5 millones de unidades (0.36-3g). La inyección intramuscular intermitente es el método usual de administración. Cantidades mucho mayores (6-120g diarios) se pueden dar por inyección durante un período de 20 minutos cada 4-6 horas a una infusión intravenosa. Tal procedimiento es útil en infecciones serias o complicaciones debidas a estos microorganismos. La administración oral de penicilina G amortiguada o de penicilina V está indicada únicamente en las infecciones menores -por ejemplo, del aparato respiratorio o de sus estructuras asociadas, especialmente en niños (faringitis, otitis, sinusitis)- a una dosis diaria de 1-4 g. La administración oral está sujeta a tantas variables que no se debe confiar en ella cuando los pacientes están gravemente enfermos.

Muchos gonococos han adquirido resistencia parcial a la penicilina, requiriendo de 1-3 unidades/ml para inhibirse. El tratamiento de la gonorrea requiere ahora de penicilina procaína a la dosis de 2.4 a 4.8 millones de unidades de una sola vez o en dos días sucesivos. En la prostatitis, artritis, salpingitis u otras lesiones gonocócicas cerradas, la misma dosis se debe dar diariamente durante 7 a 14 días, combinada con desague cuando sea necesario.

En las infecciones de las vías urinarias, grandes dosis de penicilina G (por ejemplo, 1-10 millones de unidades I.M.) pueden dar niveles suficientemente altos en la orina para inhibir bacterias coliformes gramnegativas relativamente resistentes y, en particular, Proteus mirabilis.

La benzatín-penicilina G es una sal de muy baja solubilidad en el agua para inyección intramuscular que produce niveles bajos, pero prolongados, del medicamento. Una sola inyección de 1.2-2.4 millones de unidades es satisfactoria para el tratamiento de la faringitis por estreptococo B-hemolítico. Una inyección semejante aplicada intramuscularmente una vez cada 3-4 semanas provee profilaxis satisfactoria contra la reinfección por estreptococos B-hemolíticos. La benzatín-penicilina G (2.4 millones I.M. una vez a

la semana, por 3 ó 4 semanas) también es útil para el tratamiento de la sífilis. Este medicamento nunca se debe dar por vía oral.

Vías de administración.

En contraste con la intensa acción sobre las bacterias sensibles, la penicilina generalmente no afecta a las células de los mamíferos. Exceptuando los efectos tóxicos de la penicilina cuando se aplica directamente a los tejidos del sistema nervioso central, éste antibiótico no produce efectos evidentes sobre los tejidos y órganos del hombre en dosis clínicas y aún en dosis excesivas.

Es precisamente esta selectividad para atacar las bacterias y no a las células del huésped la que convierte a la penicilina en un agente terapéutico único. La penicilina es el medicamento que más se aproxima al concepto de la "bola mágica" de Erlich, "que afectaría solamente al blanco propuesto sin afectar al huésped".

Todavía no se ha resuelto si son preferibles las concentraciones altas, mantenidas a permanencia, o las curvas de concentración con picos correspondientes a cada dosis. Es indudable que ambos métodos de medicación son eficaces. Para infecciones crónicas generalmente se prefiere el método continuo. Se ha demostrado que la droga continúa en los tejidos y abscesos por algún tiempo después de que ya no puede dosificarse en la sangre. Por tanto, la medicación continua se emplea, en primer lugar, para mantener o aumentar las concentraciones tisulares conseguidas, y para prevenir su disminución.

Intramuscular.- Por esta vía se emplean con mayor frecuencia la penicilina G y la penicilina benzatínica. La administración de penicilina G procaína produce concentraciones séricas transitorias de 3 a 5 mg por ml a menos que se administre simultáneamente probenecid. La administración de penicilina benzatínica produce concentraciones de una fracción de microgramo por milímetro cúbico de suero, que se mantienen por 3 a 4 semanas. Las inyecciones intramusculares repetidas de penicilina cristalina son muy dolorosas y pueden provocar abscesos estériles. La penicilina cristalina se administra por vía intramuscular en combinación con uno de los compuestos menos solubles para proveer una dosis de comienzo.

Intravenosa.- Las sales de penicilina solubles en agua son las únicas que se pueden administrar por vía intravenosa. Esta vía se usa de preferencia en el tratamiento inicial de infecciones graves cuando la absorción en otros sitios es imprescindible y/o se desean concentraciones séricas elevadas. La vía subcutánea se usa muy rara vez.

Oral.- Siendo la más deseable desde el punto de vista de la conveniencia, la administración oral de penicilina es menos confiable y menos eficaz que las vías parenterales. No se debe confiar en la administración por vía oral en caso de náusea, vómito o enfermedad aguda. La vía oral alcanza una eficacia máxima del 20% de la vía parenteral. Sin embargo, cuando es convenientemente controlada, la vía oral es una alternativa valiosa de la vía parenteral, especialmente para la medicación prolongada en pacientes no hospitalizados. A pesar de que las reacciones anafilácticas pueden seguir a la

medicación oral, la mortalidad en estos casos es mucho menor que cuando esta reacción sigue a la medicación parenteral.

Aplicaciones en aerosoles y tópicos.- El uso de aerosoles, cremas y ungüentos de penicilina casi ha sido eliminado por el alto riesgo de sensibilización alérgica que acompaña a su uso.

Intratecal.- La penicilina administrada a sujetos normales alcanza sólo bajas concentraciones en el líquido cefalorraquídeo. Esto ha llevado al campo intratecal de la penicilina. Al principio se producían casos de aracnoiditis adhesiva y reacciones neurotóxicas.

Estas reacciones se han reducido al mínimo limitando la dosis administrada a 1000 ó 2000 unidades por ml y administrando solo 5 a 10 ml. Se duda de la necesidad de administrar la penicilina por vía intratecal por el hecho de que esta droga atravieza la barrera hematoencefálica mucho más rápidamente cuando las meninges se encuentran inflamadas.

Intraarticular.- Aunque todavía se emplea, este método de medicación es de valor dudoso. En la mayoría de casos es suficiente el drenaje de las colecciones purulentas, la medicación parenteral y medidas de mantenimiento adecuadas. Los riesgos de introducir una superinfección y del trauma mecánico adicional deben evaluarse contra la remota posibilidad de un mayor beneficio por la administración de la droga por esta vía.

Absorción.- La penicilina se absorbe rápida y completamente de cualquier sitio de administración parenteral o por administración por aerosoles a menos que, por una modificación que disminuye su solubilidad, la absorción se vuelve lenta.

La inyección intramuscular de 300 000 unidades de penicilina cristalina acuosa produce concentraciones séricas máximas de 3 a 5 unidades por ml aproximadamente 30 a 60 minutos después de su administración. La absorción del depósito intramuscular es tan lenta que aún con dosis altas y espaciadas solo pocas hora entre sí, las concentraciones séricas no logran exceder de 3 a 5 unidades por ml a menos que sea bloqueada la eliminación renal.

Después de una dosis oral se encuentran concentraciones mensurables de penicilina durante 4 a 6 horas.

PENICILINA G POTASICA U.S.P. Y PENICILINA G SODICA U.S.P.

Son preparaciones cristalinas que se emplean indistintamente para el tratamiento de infecciones generalizadas. Las inyecciones intramusculares intermitentes no deben espaciarse más de 4 a 6 horas debido a la rápida depuración de la penicilina del organismo. Las dosis intramusculares de más de 500 000 unidades pueden causar intenso dolor. Las dosis de 300 000 unidades intramusculares cada 4 a 6 horas producen concentraciones séricas tanto o más altas que las requeridas para inhibir la mayoría de las bacterias susceptibles. La medicación intramuscular debe mantenerse solo pocos días seguidos y deben alternarse cuidadosamente los sitios de inyección para reducir al mínimo el dolor y evitar el desarrollo de reacciones inflamatorias locales y graves.

La vía intravenosa se prefiere cuando se necesita la medicación parenteral prolongada o se desea obtener concentraciones séricas elevadas. Se pueden administrar dosis hasta de 50 a 100 millones de unidades por vía intravenosa, ya sea por goteo contínuo o por inyecciones intermitentes en el tubo de la venoclisis cada 2 ó 3 horas.

PENICILINA G PROCAINA

La suspensión estéril de penicilina G procaína U.S.P. (300 000, 600 000, 3 000 000 de unidades) administrada en dosis de 600 000 unidades cada 6 a 12 horas es suficiente para la mayoría de infecciones leves o moderadamente graves producidas por gérmenes sensibles. Con dosis mayores de -- 600 000 unidades cada 6 a 12 horas se consiguen sólo ligeros incrementos en las concentraciones séricas. Cuando se desean concentraciones séricas más altas se debe emplear la penicilina G cristalina. Se producen concentraciones séricas más elevadas y con mayor rapidez con la combinación de 100 000 a 200 000 unidades de penicilina procaína, que cuando se emplea sólo ésta última.

PENICILINA BENZATINA.

La suspensión estéril de penicilina G benzatina U.S.P. (600 000 a 3000 000 de unidades) se usa en dosis únicas para el tratamiento de la faringitis por estreptococo hemolítico del grupo A, para la prevención de las infecciones -- estreptocócicas en pacientes que han tenido fiebre reumática y el tratamiento de sífilis. La penicilina benzatina no debe administrarse por vía oral -- porque se absorbe muy poco. La inyección de penicilina benzatina puede -- ir seguida por dolor intenso y fiebre. Con este tipo de penicilina son más frecuentes las reacciones alérgicas. A pesar de tener mayor riesgo que la -- medicación oral, el empleo de la penicilina benzatínica evita el olvido -- del paciente y la falta de absorción.

PENICILINA V.

Es útil para la administración oral en el tratamiento de las infecciones susceptibles a la penicilina G o a la penicilina V. Es estable en los ácidos y se absorbe alrededor del 65% de una dosis administrada. La absorción es -- más rápida y completa que en el uso de la penicilina G produciéndose con-- centraciones más elevadas con dosis similares.

La penicilina V debe administrarse sólo por vía oral aunque existen prepara-- ciones para uso parenteral. Muchas veces resulta difícil escoger los ca-- sos que deben recibir medicación oral. Esta selección depende de las si-- guientes consideraciones; susceptibilidad de los microorganismos infectan-- tes, gravedad de la enfermedad, estado de la función gastrointestinal y coo-- peración del paciente en tomar su medicamento. Cuando exista en cualquier -- ra de estos puntos duda, debe iniciarse la medicación por vía parenteral e -- investigarse el estado de absorción cuando se inicia la medicación oral.

Teniendo estas reservas en mente y contando con la cooperación del paciente y la adecuada absorción intestinal, la penicilina V es útil en el tratamiento de las infecciones leves o moderadamente graves por gérmenes que son sensibles a la penicilina procaína. Para éstos casos son suficientes dosis orales de 250 a 500 mg cada 6 a 8 horas.

Comentarios.

La gran utilidad y una baja frecuencia de reacciones indeseables no deben llevar al uso indiscriminado de la penicilina. El análisis de las reacciones graves a la penicilina revela 3 hechos:

- 1) Una reacción local o generalizada anterior a la penicilina.
- 2) La falta de investigaciones de reacciones previas por parte del médico.
- 3) Falta de preparación del médico para hacer frente a la reacción cuando ésta se presenta.

En el último punto se incluye el hecho de que, con frecuencia, se administra penicilina a pacientes ambulantes de consulta externa y muchas veces éstos pacientes se van corto tiempo después de haberse puesto la inyección. Por consiguiente, la reacción suele aparecer cuando el paciente ya ha salido, en la calle, en el automóvil o durante el retorno a su casa. Se debe esperar por lo menos una hora entre la inyección y la partida del paciente.

El aspecto más importante en cuanto a prevención de estas reacciones es el evitar la medicación con penicilina en pacientes con historia previa de reacciones alérgicas o con asma, fiebre del heno, ronchas, eccema y alergia a otras drogas. Los pacientes que presentan una reacción alérgica a la penicilina deben ser claramente informados para que, a su vez puedan informar a otros médicos y dentistas y evitar así otras exposiciones que no sean absolutamente necesarias. El uso tópico de penicilina en aplicadores, unguentos y aerosoles deben abandonarse por completo debido a los peligros de sensibilización. Se puede evitar o disminuir el riesgo de una reacción fatal usando la medicación oral, siempre que sea posible, o por lo menos para la primera dosis cuando se planea una terapéutica parenteral.

Todo médico que usa la penicilina debe estar preparado para tratar una reacción grave. Las medidas preparatorias necesarias, incluyen la posibilidad de una inmediata infusión intravenosa continua que de el acceso a la circulación, en caso de que se produzca choque. Deben tenerse a mano y listas para su uso ampollas de adrenalina, hidrocortisona y antihistamínicos. Se necesita tener listo un equipo para despejar las vías aéreas en caso de obstrucción respiratoria. La intubación traqueal es más rápida y segura que la traqueotomía. Estas medidas preparatorias deben estar al lado de la cama de un paciente que recibe penicilina y deben ser parte del equipo de consultorio de todo médico. Estas medidas se deben tomar con aquellos pacientes cuya historia sea sugestiva, aunque sólo ligeramente, de alergia a la penicilina. Si a pesar del riesgo es todavía la penicilina la droga de elección, la primera dosis debe administrarse por vía oral.

ERITROMICINA

Generalidades.

El espectro antibacteriano de la eritromicina semeja al de la penicilina, siendo activo principalmente contra microorganismos grampositivos, *Neisseria gonorrhoeae*, *Hemophilus pertusis* y hasta cierto grado contra las espiroquetas. En altas concentraciones es bactericida, efecto que es medicado principalmente por una inhibición de la síntesis de proteínas, pero en concentraciones bajas, solamente es bacteriostático. La eritromicina es el antibiótico más ampliamente usado de los del grupo macrólido. Los estafilococos desarrollan rápidamente resistencia a la eritromicina y su amplio uso en hospitales puede conducir en el término de unos cuantos meses a la conversión, -- prácticamente, de todos los estafilococos de cepas sensibles a cepas resistentes.

La acción antibacteriana de las eritromicinas es tanto inhibitoria como bactericida para los organismos sensibles. La actividad es reforzada a pH alcalino. La inhibición de la síntesis proteínica ocurre por acción sobre la unidad de 50 S de los ribosomas donde la eritromicina compete por los sitios ribosómicos de combinación, tal vez bloqueando la reacción de translocación de los aminoácidos.

En la mayor parte de las poblaciones microbianas susceptibles han surgido mutantes resistentes a la eritromicina. Las mutantes resistentes son especialmente frecuentes entre los estafilococos y su aparición en el curso de tratamiento prolongado con eritromicina es altamente predecible.

Indicaciones.

Las eritromicinas son probablemente los medicamentos de elección solamente en algunas infecciones por corynebacteria (eritrasma portadores de difteria, septicemia por difteroides), y en la enfermedad causada por *Mycoplasma pneumoniae*. La eritromicina es activa contra muchos *Mycobacteria atypicas*. Por otra parte, ellas son de lo más útiles como SUSTITUTOS DE LAS PENICILINAS en individuos con infecciones estreptocócicas o neumocócicas, quienes son hipersensibles a la penicilina.

Dentro de este grupo de medicamentos el estolato de eritromicina y la troleandomicina son absorbidos con la mayor regularidad. Sin embargo, ellos también producen las reacciones adversas más graves. Por lo tanto, se puede preferir lo menos bien absorbidos estearatos y succinato de la base,

Contraindicaciones.

La eritromicina base y sus sales y ésteres simples tienen un bajo grado de toxicidad, causando trastornos gastrointestinales moderados y rara vez sensibilización de la piel. Después de la introducción de la sal lauril sulfato del éster propiónico aparecieron numerosos estudios describiendo una hepatitis colestática por hipersensibilidad. Una exposición subsecuente reproduce por lo general síntomas parecidos a los de la pancreatitis o la colecistitis en el término de unas cuantas horas junto con alteración de las pruebas

bas funcionales hepáticas, principalmente la de la transaminasa. Aunque - la mitad de los casos pueden ser asintomáticos, se ha informado que la frecuencia de esta complicación es del 12 por ciento en pacientes tratados durante más de 14 días.

Efectos secundarios.

- a) Efectos gastrointestinales.- Anorexia, náusea, vómito y ocasionalmente diarrea acompañan a la administración oral.
- b) Toxicidad hepática.- El estolato de eritromicina y la troleandomicina - pueden producir hepatitis aguda colestática con fiebre e ictericia o mal funcionamiento hepático subclínico. Es probable que este sea una reacción de hipersensibilidad específica que puede ser desencadenada repetidamente -- con la amenaza de los mismos medicamentos. Hasta 15 por ciento de los - enfermos que reciben estos medicamentos a dosis completas durante más - de dos semanas pueden presentar pruebas anormales de funcionamiento he- pático. Algunas de estas pruebas anormales pueden ser positivamente fal- sas, pero otras indican deterioro del funcionamiento hepático. La mayor -- parte de los enfermos se recuperan completamente, pero se han comunicado algunas muertes.

Dosis.

La dosis de cualquiera de las formas de eritromicina en los adultos es de - 250 a 500 mg cada 6 horas, y 20 a 30 mg/kg/día en los niños. En infec- ciones graves se pueden dar hasta 4 g diarios a los adultos.

Dosis oral.- 0.5 g cada 6 horas para los adultos, 40 mg/kg/día para los niños.

Dosis intravenosa.- (Por ejemplo, gluceptato o lactobionato de eritromici- na) 0.5 g cada 8-12 horas para los adultos, 40 mg/- kg/día para los niños.

Vías de administración.

La eritromicina se encuentra disponible como la base libre para uso oral y - tópico, como sales y ésteres para uso oral, intramuscular e intravenoso; y en forma de la sal lauril fosfato del éster propiónico para uso oral.

Preparaciones existentes.

Eritromicina Base.

Tabletas de 100 y 250 mg,

Unguento al 1 % en base de petrolato de 15 y 30 mg.

Estolato de Eritromicina.

Cápsulas de 125 y 250 mg.

Tabletas masticables de 125 mg,

Suspensión oral de 125 mg/5 ml, de 60 y 150 ml,

Gotas de 100 mg/ml de 10 ml.

Estearato de Eritromicina.
Tabletas de 100 y 250 mg.

Etilsuccinato de Eritromicina.
Tabletas masticables de 200 mg.
Suspensión pediátrica de 200 mg/5ml de 60 y 500 ml.
Gránulos de 200 mg/5ml de 60 ml.
Gotas, 100 mg/2.5 ml 30 ml.
Inyectable (IM. de 50mg/ml, ampolletas de 2 ml y frasquitos de 10 ml.
Gluceptato de Eritromicina.
Inyecciones (IV.) de 250/20 ml, 500 mg/30 ml y de 1 g/50 ml.
Lactobionato de Eritromicina.
Frascos de 500 mg y 1 g para inyección I.V.
Troleandomicina.
Cápsulas de 125 y 250 mg
Suspensión de 125 mg/5 ml de 60 ml.
Gotas de 100 mg/ml (Tao) de 10 ml.

Comentarios.

En consecuencia, la eritromicina no se debe usar como medicamento único en el tratamiento de las infecciones estafilocócicas graves, Neumococos y estreptococos resistentes a la eritromicina están haciendo su aparición ahora.

Parece ser virtualmente completa la resistencia cruzada entre todos los miembros del grupo de las eritromicinas. La resistencia a ellas está basada probablemente sobre una proteína alterada en la unidad de 50 S del ribosoma. La resistencia no incluye la destrucción del medicamento. Existe algo de resistencia cruzada con la Lincomicina.

LINCOMICINA

Generalidades.

La lincomicina es un antibiótico elaborado por *Streptomyces lincolnensis*. - Tienen actividad antimicrobiana similar a la que tiene la eritromicina pero químicamente es bastante distinta a ella.

Muchos cocos grampositivos son inhibidos por 0.5-5mg/ml de lincomicinas. Enterococos, haemophilus, neisserias y mycoplasma son usualmente resistentes (en contraste con la eritromicina) mientras que las lincomicinas tienen poca o ninguna acción sobre la mayor parte de las bacterias gramnegativas, los bacteroides son a menudo susceptibles. Las lincomicinas inhiben la síntesis de proteínas, tal vez bloqueando la translocación del aminoácido en el ribosoma bacteriano. Se ha encontrado resistencia a la lincomicina entre estreptococos, neumococos y estafilococos. Existe cierta resistencia cruzada entre las lincomicinas y las eritromicinas.

Indicaciones.

Probablemente la indicación más importante para la lincomicina es para el tratamiento de las infecciones por cocos grampositivos, en personas hipersensibles a las penicilinas, pero las eritromicinas pueden ser preferibles para este propósito.

Una excepción puede ser el uso de las lincomicinas en las infecciones estafilocócicas de los huesos, en las cuales se ha registrado tratamientos afortunados. La meningitis no se debe tratar con lincomicinas.

Contraindicaciones.

Hasta en tanto se obtenga mayor experiencia clínica, no se recomienda, la lincomina en el recién nacido, en la profilaxis de la recurrencia del reumatismo articular agudo y en pacientes con enfermedades renales, hepáticas, endocrinas o metabólicas preexistentes. Puede haber hipersensibilidad a la droga, infecciones monilíasicas y por hongos.

Efectos Secundarios.

Los efectos secundarios comunes son diarrea, náusea y erupciones cutáneas. A veces ocurre deterioro de la función hepática (con ictericia o sin ella) y neutropenia. Diarrea grave y enterocolitis -que en ocasiones terminan con la muerte- han seguido a la administración de este medicamento, e imponen una serie de restricciones a su uso. La resina colestiramina puede ayudar a reducir la diarrea y la colitis asociadas a las lincomicinas.

Dosis.

Dosis orales de 0,5 g de lincomicina cada 6 horas son fácilmente absorbidas

en el intestino, si se toman apartadas de las comidas, y dan concentraciones séricas de 2.5 mg/ml.

La lincomicina se puede dar a la dosis de 0.5g cada 6 horas (30-60 mg/kg/día en los niños).

Vías de administración.

La lincomicina se puede dar intramuscular o intravenosamente para lograr niveles algo más elevados. Las lincomicinas se distribuyen ampliamente en el cuerpo pero no aparecen en el sistema nervioso central en concentraciones significativas. La excreción se hace principalmente por el hígado, bilis y orina.

La lincomicina puede ser dada por vía oral a la dosis de 0.5 g cada 6 horas (30-60 mg/kg/día en los niños)

Lincomicina (lincocin)

Cápsulas de 250 y 500 mg.

Inyectable 300 mg/ml en frasquitos de 2 y 10 ml o jeringa desechable de 2 ml.

Comentarios.

Mientras que las lincomicinas tienen poca o ninguna acción sobre la mayor parte de las bacterias gramnegativas, los bacteroides son a menudo susceptibles, inhiben las síntesis de proteínas, tal vez bloqueando la translocación del aminoácido en el ribosoma bacteriano.

Existe cierta resistencia cruzada entre las lincomicinas y las eritromicinas.

TETRACICLINAS

Generalidades.

Las tetraciclinas forman un gran grupo de medicamentos con una estructura - básica y actividad comunes.

La tetraciclina químicamente representó una molécula ligeramente más simple y pudo ser preparada a partir de la clortetraciclina, quitando catalíticamente el cloro. En forma cristalina seca, las diversas sales no muestran - deterioro alguno después de un almacenamiento prolongado. Sin embargo en solución acuosa hay una pérdida progresiva de actividad antibacteriana cuyo grado depende hasta cierto punto del pH de la solución. En general, las soluciones acídicas son más estables y son las usadas para la administración parenteral.

Las tetraciclinas son inhibidores efectivos de la fosforilación y de la síntesis de proteínas. Se supone que la última es la base de su eficiencia terapéutica. Las tetraciclinas parecen inhibir la unión del aminoácido-RNA a las unidades de 30 S de los ribosomas. Las células sensibles concentran a las tetraciclinas en extensiones varias veces mayor que la que se encuentra en el medio ambiente.

Indicaciones.

Las tetraciclinas son los más típicos antibióticos de "amplio espectro". - Son efectivos contra una variedad de microorganismos y, por ésta razón, - se usan a menudo indiscriminadamente.

Las tetraciclinas pueden ser los medicamentos de elección en el cólera o - en infecciones por Mycoplasma pneumoniae o por miembros psitacosis-LGV tracoma. Son útiles en las infecciones bacterianas mixtas relacionadas con las vías respiratorias, especialmente sinusitis y bronquitis, pueden ser empleadas en muchas infecciones por bacterias grampositivas y gramnegativas, incluyendo bacteroides (siempre que el microorganismo sea susceptible), en la mayor parte de las infecciones rickettsianas, y en la amibiasis y el paludismo (P. Falciparum). Se han usado en las neumonías y en las infecciones de las vías urinarias y cutáneas, particularmente en la acné.

Contraindicaciones.

Las reacciones de hipersensibilidad (fiebre, yatrogenia, erupciones cutáneas) a las tetraciclinas parecen ser infrecuentes. La mayor parte de los efectos colaterales se deben a la intoxicación directa por el medicamento - o a la alteración de la flora microbiana.

Efectos secundarios.

a) Efectos gastrointestinales secundarios. - La náusea, el vómito y la diarrea son las manifestaciones más frecuentes para discontinuar la medica-ción con tetraciclinas. Durante los primeros días de administración ellas -

parocen ser atribuibles a la irritación local directa del intestino.

La náusea, la anorexia y la diarrea usualmente pueden ser controlados administrando el medicamento con alimentos o carboximetilcelulosa, reduciendo la dosis o discontinuando el medicamento.

b) Estructuras óseas y dientes.- Las tetraciclinas se unen fácilmente al calcio depositado en el hueso o dientes de reciente formación. Cuando el medicamento se da durante el embarazo se puede depositar en los dientes - fetales produciendo fluorescencia, cambios de color, displasia del esmalte, deformidad o inhibición del crecimiento. Si el medicamento se da a los niños menores de 6 años durante largos períodos, pueden resultar cambios - semejantes.

c) Toxicidad hepática.- Las tetraciclinas probablemente pueden deteriorar el funcionamiento hepático, especialmente durante el embarazo, en pacientes con insuficiencia hepática preexistente, y cuando se dan dosis altas - intravenosamente. Se ha comunicado necrosis hepática con dosis diarias - de 4 g I.V. o mayores.

d) Toxicidad renal.- Acidosis tubular renal y otras formas de lesión renal que dan por resultado retención de nitrógeno han sido atribuidas a la administración de preparaciones caducas de tetraciclinas. Esto no ha sido probado para las preparaciones recientes.

e) Toxicidad tisular local.- La inyección intravenosa puede producir trombosis venosa. La inyección intramuscular produce irritación local dolorosa que puede provocar infiltración.

f) Fotosensibilización.- La administración generalizada de tetraciclina, - puede inducir sensibilidad a la luz del sol o a la radiación ultravioleta, - particularmente en las personas rubias.

g) Reacciones vestibulares.- Mareos, vértigo, náusea y vómito se han observado particularmente con la minociclina, 35-70 por ciento de pacientes mostraron tales reacciones.

Dosis.

Las tetraciclinas son administradas usualmente por vía oral y los adultos - pueden recibir dosis que van desde 250 a 750 mg (demetilclortetraciclina - 150 a 300 mg) cada 6 horas.

Dosis oral.- La dosis mínima efectiva de las tetraciclinas rápidamente excretadas, equivalente a la que corresponde al clorhidrato de tetraciclina, - es de 0.25 g 4 veces al día para los adultos y de 20 mg/kg/día en los niños. Para las infecciones generales graves está indicada una dosis 2-3 veces mayor durante por lo menos 3-5 días. En la acné es popular una dosis de 0.25g-0.5g por día durante muchos meses.

Algunas tetraciclinas lentamente excretadas son menos confiablemente absorbidas, producen niveles más bajos y probablemente no se deberían emplear en las infecciones graves. La dosis mínima efectiva al día es de 600 mg - para la demeclociclina o la metaciclina; de 100 mg para la doxiciclina y de 200 mg para la minociclina.

Dosis parenteral.- Existen varias tetraciclinas para inyección intramuscular o intravenosa en dosis de 0.1-0.5g cada 6-12 horas (en los niños se

pueden emplear 10-15 mg/kg/día).

Vías de administración.

Se prefiere la administración oral, pero a veces es necesario administrar la droga parenteralmente. Se dispone de formas especiales de las diversas tetraciclinas para administración intramuscular o intravenosa. La dosis parenteral usualmente es de 10 a 20 mg/kg.

La familia de las tetraciclinas está representada por tantas formas de dosificación para cada miembro que no es posible dar aquí una descripción detallada de cada una de ellas. Al lado de las formas principales de dosificación que se discutirán a continuación hay soluciones y ungamentos oftálmicos y óticos, polvos, tabletas, trociscos, tabletas vaginales, y conos y pastas dentales.

Clorhidrato de Clortetraciclina. U.S.P. Clorhidrato de Aureomicina.

Es presentado en cápsulas de 50, 100 y 250 mg. La dosis promedio para adultos es de 0.5 g cada 6-8 horas. Si no se obtiene una respuesta satisfactoria o en casos de infecciones más graves, debe aumentarse la dosis. Los niños deben recibir 25mg/kg de peso corporal al día.

El clorhidrato de clortetraciclina, amortiguada con glicinato de sodio, puede administrarse intravenosamente en una concentración que no exceda a 100 mg/ml. La dosis diaria total por esta vía es de 20 a 25 mg/kg de peso corporal, la cual puede dividirse en 2, 3 ó 4 inyecciones espaciadas a intervalos iguales.

Tetraciclina, U.S.P.

Se dispone de ella para su uso oral en forma de clorhidrato como complejo de fosfato, con glucosamina añadido. Los últimos tres grupos con aditivos son preferidos debido a su mayor absorción lo cual se hace posible al bloquear la quelación con cationes divalentes. Todos estos productos se encuentran disponibles en cápsulas de 250 mg y 125 mg, como jarabe que contiene 125 mg en 5 ml y como gotas pediátricas que contienen 100 mg en 1 ml. La dosis adulto promedio es de 500 mg cada 6-8 horas. Puede requerirse una dosis mayor. En los niños la dosis diaria promedio es de 25 mg/kg en dosis divididas.

La tetraciclina para uso intramuscular e intravenoso se administra en una dosis diaria de 10 mg/kg aproximadamente, en dos o tres dosis divididas.

Comentarios.

Hoy en día las tetraciclinas son los antibióticos de amplio espectro más utilizadas. La actividad antimicrobiana de todos los miembros de la familia tetraciclina es esencialmente la misma y ha sido demostrada contra una amplia variedad de cocos y de bacilos, tanto aeróbicos como anaeróbicos, grampositivos y gramnegativos.

El uso externo de las tetraciclinas en las enfermedades menores ha elevado la aparición de resistencia, aún entre las especies altamente susceptibles, por ejemplo, neumococos y estreptococos del grupo A. El uso en gran es-

cala de estos medicamentos en los hospitales ha dado por resultado la selección de organismos resistentes, a las tetraciclinas, particularmente esta filococos y pseudomonas, como agentes comunes sobreinfectantes. En alguna medida a las tetraciclinas (entre otros medicamentos antibióticos) se les puede acreditar la creciente frecuencia de infecciones micóticas en -- pacientes hospitalizados, gravemente enfermos.

Por otro lado, las tetraciclinas han sido de gran beneficio no sólo para el control de la infección existente, sino también para la quimoprofilaxis de - la bronquitis crónica y de la bronquielectasía, manteniendo a muchas personas bien y trabajando.

PENICILINAS SEMISINTÉTICAS

Como se mencionó que el núcleo de las penicilinas es el ácido 6-aminopenicilánico, y no presenta actividad antimicrobiana. Este es el punto de partida para la obtención de penicilinas semisintéticas.

Inicialmente este núcleo se detectó en los productos de fermentación del *penicillium chrysogenum* por la discrepancia existente entre los estudios químicos y microbiológicos. El ácido 6-aminopenicilánico se forma en mayor cantidad cuando se fermenta penicilina sin adicionar un "precursor" al medio cultivo.

Al núcleo de la penicilina se agregan diferentes cadenas laterales para así obtener diversas penicilinas semisintéticas, estas penicilinas pueden presentar características que no se encuentran en las penicilinas naturales, por ejemplo, estabilidad frente a las penicilinas, amplio espectro, actividad contra *pseudomona*, etc.

AMPICILINA

Generalidades.

Es una penicilina semisintética de amplio espectro, con acción bactericida y prácticamente atóxica. Químicamente es la D-aminobencilpenicilina. La actividad de la ampicilina frente a las bacterias grampositivas es ligeramente inferior a la actividad de la penicilina G, pero supera a ésta última en eficacia contra el estreptococo *Faecalis* (enterococo). Tanto la ampicilina como la Penicilina G son inactivos contra el estafilococo productor de penicilinas porque ambos son inestables frente a la penicilina.

Algunas cepas de *E. coli* son resistentes a la ampicilina; una parte de éstas por su capacidad para formar enzimas que destruyen a la ampicilina (amidasa y/o betalactamasas).

Indicaciones

Las indicaciones de mayor importancia comprenden las infecciones por bacterias coliformes y cepas de *proteus mirabilis* resistentes a las tetraciclinas, las salmonelosis generalizadas incluyendo la fiebre tifoidea (donde puede tener igual eficacia que el cloramfenicol) meningitis causadas por *Haemophilus influenzae* e infecciones enterocócicas. Las concentraciones y la excreción de la ampicilina por la bilis sugieren que puede ser de especial utilidad para el tratamiento de las colangitis por bacilos coliformes o salmonela.

Está indicada en infecciones de las vías respiratorias altas y bajas, infecciones de la piel y tejidos blandos.

Contraindicaciones.

La ampicilina presenta alergenicidad cruzada completa con las demás peni-

cilinas, es decir, si una persona es alérgica a una penicilina natural o semisintética lo será también a la ampicilina.

Efectos Secundarios.

El rash a la ampicilina es de tipo eritematoso (sensibilización a los polímeros) y de tipo urticarial o papular en la reacción alérgica de las penicilinas.

Vías de administración.

La ampicilina se puede administrar por vía oral o parenteral. La forma oral es estable en los ácidos y se administra en forma similar a la Penicilina G y a la penicilina V. Es muy poco soluble en agua y todavía se busca en vehículo adecuado para su administración parenteral.

Dosis.

Se administra en cápsulas, tabletas y ampollitas de 250 y 500 mg pero aún sólo para uso experimental.

Suspensión oral.- 60 y 80 ml conteniendo 125mg/5ml; 80 ml conteniendo 250/5 ml.

Cápsulas de 250 y 500 mg.

Inyectable (I.M. I.V.) frascitos con 125, 250 500 y 1000 mg.

Parace ser que se requieren dosis de 25 a 100mg/kg de peso corporal por día, administrado por vía oral, cada 4-6 horas ya que debido a las concentraciones prohibidas necesarias varían para cada microorganismo, no se puede afirmar cuál es la dosis necesaria definitiva.

POLIMIXINA (COLY-MYCIN)

Generalidades.

Las polimixinas son un grupo de polipéptidos básicos activos selectivamente contra los bacilos gramnegativos. Las polimixinas A, B, C, D, y E se obtuvieron de un bacilo esporulado grampositivo (*Bacillus polymyxa*, β , *aerospurus*) en 1947. Todas las polimixinas excepto la B y la E, han sido desechadas debido a la excesiva nefrotoxicidad. La colistina, introducida en 1950, es idéntica a la polimixina E.

Indicaciones.

Las polimixinas son medicamentos de elección para el tratamiento de las infecciones causadas por pseudomonas o bacterias coliformes resistentes a otros medicamentos antimicrobianos. El tratamiento con polimixinas está limitado por la distribución y penetración restringidas de los medicamentos, por su toxicidad y por su unión con muchos componentes tisulares. La toxicidad general de las polimixinas B y E limitan tanto la dosis como la duración de la terapéutica. Los dos componentes tienen toxicidades semejantes y las diferencias observadas son atribuibles en gran parte a diferencias entre el sulfato y el metansulfonato. Sin embargo, el colistimetato parece ser el menos nefrotóxico de todas las polimixinas ordinariamente disponibles. Niveles sanguíneos muy altos de cualquier polimixina pueden causar paro respiratorio, el cual se puede revertir con CaCl_2 . Estas son las contraindicaciones de las polimixinas.

Dosis y Vías de administración.

La inyección intramuscular de sulfato de polimixina B o E (sulfato de colistina) es dolorosa y requiere de la administración simultánea de un anestésico local. Por esta razón se prefiere el complejo de metansulfonato que a veces incluye un anestésico local y libera lentamente el medicamento activo después de inyección intramuscular. La dosis general total puede ser de 2,5-5 mg/kg/día.

Comentarios.

Las polimixinas se están volviendo más importantes debido a los numerosos crecientes de enfermos infectados con pseudomonas y enterobacterias. Estos a menudo son pacientes hospitalizados por otras enfermedades y menoscabo de la función renal quienes, por tanto, requieren de ajustes cuidadosos, individualizados, de un régimen de polimixina. En cuanto a su uso en la odontología las polimixinas no son aconsejables por su toxicidad.

BIBLIOGRAFIA

- 1) ANTIBIOTICS "ADMINISTRATION AND DOSAGE"
DRUG-INACTIVATING ENZYMES OF BACTERIA GROWN IN SUBMINIMAL
INHIBITORY CONCENTRATIONS OF ANTIBIOTICS. GRASSI GG. REV.
INFECTS DIS 1979. SEP-OCT; 1 (5) 852-7
- 2) BIRO, CARLOS E.
TERAPEUTICA ANTIMICROBIANA
SEXTA EDICION, 1977
EDITORIAL DIOGENES, S.A. MEXICO
- 3) DRILL, VICTOR A.
FARMACOLOGIA MEDICA
PRIMERA EDICION, 1974
EDITORIAL PRENSA MEDICA MEXICANA
- 4) GOODMAN, LOUIS S.
GILMAN, ALFRED
BASES FARMACOLOGICAS DE LA TERAPEUTICA
QUINTA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 5) GOTH, ANDRES
FARMACOLOGIA MEDICA
OCTAVA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 6) MEYERS, FREDERIK H.
MANUAL DE FARMACOLOGIA CLINICA
TERCERA EDICION 1977
EDITORIAL EL MANUAL MODERNO
- 7) SECRETARIA DE SALUBRIDAD Y ASISTENCIA
CUADRO BASICO DE MEDICAMENTOS DEL SECTOR
PUBLICO
MEXICO 1979.

UNIDAD IV

ANALGESICOS

Generalidades.

Se conoce con el nombre de analgésicos no narcóticos o antipiréticos a un grupo de medicamentos que alivian el dolor y modifican la reacción psíquica asociada sin abolir la conciencia. Desde el punto de vista de su potencia y de su capacidad de producir adicción se les divide en débiles o no narcóticos y en potentes o narcóticos.

Los analgésicos no narcóticos o antipiréticos mitigan el dolor ligero de diversas causas, incluyendo algunas de las dolencias más comunes -cefalea tensional, dolores articulares y de los músculos, el malestar de las infecciones virales, etc. También abaten la temperatura corporal elevada y reducen la inflamación de la artritis reumatoide y de la fiebre reumática. Estos analgésicos actúan periféricamente como antagonistas de los agentes -analgésicos liberados en los tejidos dañados al fijarse competitivamente en los quimiorreceptores.

Los verdaderos analgésicos como el Acido acetil-salicílico y la fenacetina no son lo suficientemente potentes para elevar el umbral del dolor ya que -bajo su acción, los tratamientos levemente dolorosos provocan respuesta -en pacientes con bajo umbral al dolor, por ello, los medicamentos que en forma satisfactoria son capaces de evitar el dolor se encuentran dentro del grupo de anestésicos, en particular los generales, ya que éstos son fármacos que producen depresión del S.N.C. manifestada por analgesia, inconsciencia, hiporreflexia y relajación muscular.

En el uso de los analgésicos deben tomarse en cuenta los siguientes principios terapéuticos:

1. La dosis deberá ser la mínima requerida para reducir el dolor hasta un nivel de intensidad tolerable.
2. El intervalo entre las dosis deberá ser el máximo de tiempo que de lugar a una mejoría sostenida del dolor.
3. La severidad de los efectos adversos se considerara en base al caso clínico en particular.
4. Cuando sea posible deberá indicarse el medicamento de elección por ejemplo, carbamazepina en la neuralgia trigeminal.
5. Como los analgésicos narcóticos y los no narcóticos se potencializan, -en caso de dolor pueden utilizarse medicamentos mixtos.

Dentro de los analgésicos no narcóticos, el Acido acetilsalicílico (A.A.S.) es el medicamento más importante y más comunmente usado del grupo. Otros analgésicos antipiréticos ofrecen ventaja sobre el A.A.S. en unas cuantas situaciones, pero la mayor parte de ellos son mucho más tóxicos. La mayoría se obtienen sin receta y se anuncia un gran número de combinaciones y preparados.

Efectos farmacológicos en general de los analgésicos.

1. Analgésico.- El dolor de muchos tipos es mitigado, El dolor puede ser muscular, vascular, inflamatorio (ya sea de origen traumático o -

irritativo) o tensional de cabeza u otro distinto, artrítico por bursitis, post partum, incisional, post extracción y una región de otros, incluyendo el dolor del cáncer. La importancia de esta extensa lista es poner de relieve que la intensidad y no la naturaleza del dolor es que determina si el A.A.S. es efectivo.

- II. Antipirético.- La temperatura normal del cuerpo no sólo es ligeramente afectada, pero la fiebre si es reducida. La caída de temperatura se debe a la dilatación de los vasos sanguíneos superficiales con aumento de la disipación del calor y no al decrecimiento en la producción de calor. La caída puede ser precipitada e ir acompañada de sudación profusa. El enfriamiento debido a la evaporación del sudor no es esencial para la acción de estos antipiréticos, persistiendo el efecto aunque se impida la sudación administrando atropina. El A.A.S. también abate la temperatura experimentalmente elevada de los animales con lesiones hipotalámicas que suprimen la respuesta de sudación al calor. El efecto antipirético, así, es mediado por la vasodilatación consecutiva a una "reposición" del centro de control hipotalámico de la temperatura. El efecto antipirético puede ser ensayado y analizado en animales después de la producción de fiebre inyectando endotoxinas bacterianas y otros pirógenos.
- III. Antiinflamatorio.- Además de aliviar el dolor y abatir la temperatura, los analgésicos ligeros en grandes dosis también reducen la inflamación en situaciones como la artritis reumatoide o la fiebre reumática aguda. La acción antiinflamatoria de los salicilatos se puede deber a un efecto vascular puesto que otros vasodilatadores -por ejemplo, los betasimpaticomiméticos- también reducen la inflamación experimental.

Indicaciones.

Dolor. Los analgésicos antipiréticos tienen una potencia contra algunas clases de dolor comparable a la que poseen pequeñas dosis de narcóticos y deben ser probadas en la mayoría de los casos donde es necesaria la analgesia. En general, no se puede esperar que responda el dolor visceral que produce calambres, pero algunos tipos -por ejemplo, el de la dismenorrea- pueden, de hecho, responder al A.A.S.

Fiebre. Obviamente, los medicamentos antipiréticos no deben reemplazar a la terapéutica específica, pero no hay razón para que no se usen mientras se esta presentando el efecto del medicamento específico o cuando no se dispone de terapéutica específica -por ejemplo, en el caso de la influenza-. No sólo baja la temperatura sino que también se reducen el malestar general y las molestias musculares.

Estados inflamatorios específicos. Estos medicamentos se usan en el tratamiento de la artritis reumatoide y de la fiebre reumática aguda. Se pueden dar junto con los corticoesteroides.

Contraindicaciones

La mayor parte del A.A.S. se vende y se usa sin receta y la precaución im-

portante se debe advertir a las familias con niños: El A.A.S. -y de hecho todas las medicinas- se deben guardar fuera del alcance de los niños. El A.A.S. es el agente más a menudo responsable de envenenamientos en los niños menores de 5 años. Debe ser conservado en el frasco a prueba de niños en el cual se surte. Las preparaciones coloridas, sápidas y líquidas se deben tratar con especial cuidado. El A.A.S. se debe dar con gran cuidado a los pacientes con historia de úlcera péptica, de sangrado o de asma a una administración previa.

Efectos secundarios.

Los efectos colaterales del A.A.S. usualmente están limitados a molestias epigástricas, agruras o náusea. Cuando se deben emplear dosis grandes - como en la artritis reumatoide o en algunos de los individuos más sensibles, pueden aparecer tinnitus u otros síntomas de salicilismo. El mecanismo por el cual el A.A.S. causa irritación gástrica y sangrado es importante porque también está relacionado con el de otros medicamentos y aún, posiblemente, con la patogenia de la úlcera péptica.

Ordinariamente la mucosa gástrica es una barrera impermeable que no es dañada por el ácido, las enzimas y los medicamentos irritantes. No sólo ocurren efectos colaterales iniciativos de irritación gástrica, sino que la magnitud del sangrado oculto en el aparato digestivo aumenta después de la administración de A.A.S. La pérdida de sangre se mide marcando los glóbulos rojos del sujeto y registrando la radioactividad recuperada en las heces después de administrar el medicamento. Normalmente se pierde menos de 1 ml de sangre en las heces por día. La cifra aumenta tal vez hasta 4 ml/día después de ingerir A.A.S. ordinario a las dosis usuales, pero puede llegar a 10 ml o aún a 30 ml ocasionalmente en algún enfermo.

El A.A.S. es el medicamento casero más común y su ingestión por curiosidad o actitud imitativa lo convierte en la causa más común de envenenamiento de los niños muy pequeños. Como regla general, se puede esperar intoxicación grave si la cantidad ingerida excede de 150-175 mg/kg.

Si el paciente se va suficientemente pronto y si la cantidad ingerida se desconoce o si se sabe que excede de la guía arbitraria de 150 mg/kg se debe hacer un lavado gástrico. La hipertermia se debe tratar tan vigorosamente - como sea necesario con agua tibia o esponjas con alcohol o bolsas de hielo. El volumen de orina se debe mantener a un elevado nivel (500 ml/hora). Cuando el volumen de orina o las mediciones directas establecen que se ha presentado una alcalosis compensada o una acidosis, se debe administrar bicarbonato y el líquido debe contener iones de potasio.

Clasificación,

Los analgésicos antiinflamatorios se clasifican en cuatro grupos:

- 1) Salicílicos
- 2) Pirazolónicos
- 3) Anilínicos
- 4) Sintéticos

1) Derivados Salicilicos.

Generalidades.

El ácido acetilsalicílico (A.A.S.) es el derivado salicílico más frecuentemente usado y el analgésico no narcótico más efectivo; también es el más barato y relativamente tiene baja incidencia de efectos colaterales usado a dosis terapéuticas, constituye la base de comparación para nuevos medicamentos usados en dolor leve o moderado.

Indicaciones.

Generalmente se emplea como analgésico, pero también suprime la inflamación, inhibe la agregación plaquetaria y tiene propiedades antipiréticas. Recientemente se ha descubierto que inhibe la secreción de prostaglandinas. Su uso en odontología está limitado a casos de dolor leve, ya que cuando es más intenso requiere estar combinado con otros compuestos para lograr el control del síntoma.

El efecto analgésico del A.A.S. se produce con dosis de 0.3 a 0.6 g cada 4 horas. Mayores dosis no aumentan su efecto analgésico, pero producen efectos indeseables. En el niño la dosis de A.A.S. es de 50 a 65 mg/kg/día, dividido en 4 ó 5 tomas.

Contraindicaciones.

Los derivados salicilicos usados como analgésicos producen efectos adversos en menos del 30% de los pacientes. Los trastornos colaterales no son graves a excepción de la intoxicación por A.A.S. llamada salicilismo y manifestada por cefalea, acúfenos, confusión mental, diaforesis, trastornos gastrointestinales, taquicardia y taquipnea, pudiendo evolucionar hasta el sopor, hipertermia, hiperventilación, con desequilibrio hidroeléctrico, colapso cardiovascular, insuficiencia respiratoria y muerte.

Efectos secundarios.

Los trastornos que más frecuentemente producen los derivados salicilicos son los siguientes:

A nivel gastrointestinal, malestar epigástrico, náusea, vómito, anorexia, gastritis, sangrado (melena), pirosis y retención gástrica. En sistema nervioso el cuadro de salicilismo en piel, erupciones eritematosas, escarlatinaiformes o eczematoideas y pruriginosas; en sangre disminución de la adhesividad plaquetaria, ocasionando petequias y agranulocitosis. Entre las reacciones alérgicas se encuentran la de urticaria, edema angioneurótico y asma. El A.A.S. retrasa el tiempo de coagulación. Las personas que toman este medicamento no deben tomar anticoagulantes.

Dosis y vías de administración

Entre las preparaciones a base de salicilicos se encuentran las siguientes:

Tabletas de 0.5 y 0.1 g; grageas con capa entérica, cápsulas de 0.5 g en forma de micrográn recubiertos de glicina, ácido acetilsalicílico (efervescente), presentación inyectable en forma de acetilsalicilato de lisina para aplicación intramuscular o en venoclisis, y formas compuestas como la asociada a cafeína.

En odontología son recomendables las formas simples, ya que las que contienen protector de mucosa gástrica se utilizan en tratamientos prolongados por ejemplo, en reumatología, en estos casos su absorción es más lenta y la eficacia se reduce porque la absorción ocurre en el estómago y en las porciones iniciales del intestino delgado.

ACIDO ACETILSALICILICO U.S.P. B.P. (Aspirina).

Se usa como tabletas comprimidas o cápsulas de .3 y .6 g que es la dosis para adultos. Se dispone comunmente de tabletas que contienen .3 g de aspirina más una base efervescente. Tabletas de aspirina que parecen dulces y que contienen 80 mg por tableta. Se encuentran disponibles para niños - pero tienen peligros obvios. También hay supositorios hasta de .9 g.

SALICILATO DE SODIO. U.S.P.

Puede obtenerse como tabletas de .3 y .6 g o en solución estéril para inyecciones. La dosis promedio de salicilato de sodio es de 1 g.

ACIDO SALICILICO, U.S.P. B.P.

Es usado muy comunmente en forma de unguento en el tratamiento de epidermofitosis. El unguento de Whitfield es a base de ácidos benzoico y salicilato N.F.; contiene 5 % de ácido salicílico y 12 % de ácido benzoico, en una base de grasa y petrolato.

SALICILATO DE METILO. U.S.P. (Aceite de Gualteria)

Solo para uso externo. También se encuentra disponible salicilato para empleo oral.

2) Derivados Pirazolonicos.

Generalidades, indicaciones y contraindicaciones.

Los analgésicos de esta clase son de acción prolongada y probablemente más poderosos en los padecimientos reumáticos agudos que el A.A.S., pero también son más tóxicos, la antipirina, la más antigua y menos tóxica del grupo, es la menos usada; la más toxica y más intensamente anunciada fenilbutazona es la que se emplea con más frecuencia.

Los efectos terapéuticos son semejantes a los del A.A.S., o sea que estos medicamentos son analgésicos, antipiréticos y antiinflamatorios.

Los medicamentos de la pirazolona ejercen un efecto antipirético en algunas

situaciones en las cuales el A.A.S. no es completamente efectiva -por ejemplo, en las enfermedad de Hodgkin con fiebre que no responde a los salicilatos o a la quimioterapia-. Probablemente también son más potentes como agentes analgésicos y antiinflamatorios en la artritis, bursitis y tromboflebitis. No hay justificación para el uso de la aminopirina o de la dipirona.

La antipirina se puede usar oralmente a la dosis de .3 a .6 g cada 4-6 horas, como alternativa del A.A.S. El volumen de distribución de la antipirina o de su metabolito, N-acetil-4-aminopirina, también se puede usar para medir el agua total del cuerpo.

La fenilbutazona y oxifenbutazona (Butazolidin y Tanderil). La butazolidin, el Tanderil y la Butazolidin Alka se encuentran entre los 200 medicamentos más comunmente recetados por los médicos de E.U.A., lo que sugiere que a menudo son usados como medicamentos de primer tratamiento, más que como alternativos del A.A.S. Sin embargo, las restricciones sobre su uso y las contraindicaciones y precauciones que forman parte de los marbetes del productor son tan estrictas y extensas que la responsabilidad sobre cualquier resultado adverso probablemente se volvería contra el médico. Los medicamentos no deberían de usarse sin antes referirse a las instrucciones del envase.

El uso de estos medicamentos se sugiere o se permite en la artritis reumatoide o en la espondilitis, osteoartritis, artritis psorásica, hombro doloroso tromboflebitis superficial aguda y artritis gotosa aguda.

Se afirma que la dosis diaria es de 300 a 600 mg/día según el marbete. Una posición más conservadora limita la dosis diaria a 200 mg. Estos medicamentos se deben discontinuar sino se observa mejoría en 4-5 días.

Efectos secundarios.

La toxicidad de los analgésicos de pirazolona restringe su uso.

La antipirina causa menos efectos colaterales que el A.A.S., rara vez se le ha asociado con agranulocitosis. Ha causado una erupción eritematosa -alérgica, a menudo alrededor de la boca, que deja áreas pigmentadas cuando desaparece.

En E.U.A., cualquier preparación o mezcla que contenga aminopirina o dipirona, ahora debe llevar un rótulo advirtiendo que el medicamento puede causar agranulocitosis y que sólo se debe emplear cuando está específicamente indicado solamente cuando los medicamentos menos tóxicos -por ejemplo, los salicilatos- hayan resultado ineficaces o no sean tolerados. La reacción es de origen alérgico, no está relacionada con la dosis y se debe a una destrucción periférica súbita de los granulocitos.

La fenilbutazona y su metabolito, la oxifenilbutazona, frecuentemente causan efectos colaterales y las reacciones tóxicas graves son suficientemente frecuentes para que su uso sea gradualmente restringido. Los efectos tóxicos relacionados con la dosis incluyen retención de sodio y edema, boca seca, náusea y vómito, ulceración péptica y hemorragia y casos raros de necrosis de los túbulos renales y del hígado. Las reacciones alérgicas incluyen dermatitis, la cual en raras ocasiones se vuelve exfoliativa y agranulocitosis.

La fenilbutazona puede causar una reacción leucemolde reversible, de mayor importancia, sin embargo, es la posibilidad (todavía no bien establecida) de que su uso crónico pueda estar asociado a una elevada incidencia de leucemia aguda.

La administración de fenilbutazona incrementa los efectos de la tabutamida y de la warfarina.

Vías de administración.

Or dinariamente estas drogas se dan oralmente. En Europa se ha usado parenteralmente una mezcla de aminopirina y una droga relacionada, la fenilbutazona.

Preparaciones y dosis.

Antipirina N.F. se presenta como polvo.

AMINOPIRINA.

El derivado 4-dimetilamino de la antipirina. Se presenta en tabletas de .3 g, la dosis usual es de .3 a .6 g.

Existen mezclas comerciales de aminopirina y antipirina con acetofenetidina, cafeína, barbitúricos y otras drogas. El derivado de la antipirina, el sulfonato de 4-metilaminometanosídico, se presenta con el nombre de Dipyrina. Su acción y toxicidad son parecidas a las de la aminopirina.

FENILBUTAZONA.

Se presenta en tabletas de 100 mg. También se encuentra disponible en forma de una preparación amortiguada y con esteroides. Usualmente es administrada por vía oral a una dosis inicial de 300 a 600 mg diariamente, dividida en 3 ó 4 dosis y administrada con leche o con las comidas para disminuir la intolerancia gástrica.

Esta dosificación puede continuarse por una semana y si se presenta mejoría es seguida por dosis de mantenimiento reducido gradualmente hasta 100 a 200 mg por día. El tratamiento con esta droga debe cesar al aparecer una reducción en los elementos formes de la sangre.

OXIFENBUTAZONA (Tanderil)

Deberá usarse sólo cuando una medicación más segura sea ineficaz. En el adulto deben darse 100 mg 3-4 veces al día. Se informa que después de su uso ocurren náusea, edema, erupción, úlcera péptica, reacciones de hipersensibilidad del tipo de enfermedad del suero, estomatitis, hepatitis, agranulocitosis, anemia, leucopenia y trombocitopenia.

Como la fenilbutazona, tiene propiedades antiinflamatorias, antipirética y analgésica. Disminuye la hinchazón y la rigidez de las articulaciones en varias enfermedades reumáticas y puede ser útil en el tratamiento de

la gota aguda, la artritis reumatoide activa y enfermedades relacionadas.

3) Derivados Anilínicos.

Generalidades, indicaciones y contraindicaciones.

La fenacetina y el acetaminofén son los compuestos de este grupo de analgésicos que se utilizan más en la práctica. Se trata de derivados de la acetanilina, que tienen efectos analgésico moderado; pueden indicarse como sustitutos en pacientes que son alérgicos a los salicilatos o que por alguna razón por ejemplo, úlcera péptica no toleran derivados salicílicos. La dosis usual de estos compuestos denominados también paraminofenoles es de 0.3 a 0.6 g, administrados cada 4 horas por vía oral; en los niños se utiliza en dosis de 60 mg cada 4 a 6 horas para menores de 1 año; hasta 120 mg de 1 a 4 años y hasta de 240 mg de 4 a 8 años de edad, cada 4 a 6 horas.

Efectos secundarios.

La toxicidad de estos compuestos se presenta cuando se ingieren en grandes dosis y por períodos prolongados y se manifiesta en forma de metahemoglobinemia, la que da origen a cianosis, disnea, debilidad muscular y dolor anginoso. Se han reportado muy pocos casos de anemia hemolítica con el uso de fenacetina. Estos productos no producen sangrado gástrico, sólo ocasionales reacciones cutáneas en forma de rash. El acetaminofén produce menos efectos indeseables que la fenacetina. Excepcionalmente se ha reportado daño hepático y renal con estos compuestos, los cuales están contraindicados cuando existe defecto de coagulación o cuando se usan conjuntamente anticoagulantes.

Dosis y vías de administración.

Entre las preparaciones a base de anilínicos se encuentran las siguientes: acetaminofén en cápsulas de 300 mg, tabletas de 500 mg, solución de 100 mg/ml, supositorios de 300 mg, y compuestos de clorfeniramina. De estas preparaciones son útiles en odontología las presentaciones orales ya que la potencia analgésica es igual a la del ácido acetilsalicílico, aunque su efecto antipirético sea menor que éste. Por otra parte, usados en períodos cortos de tiempo prácticamente no da lugar a efectos indeseables.

4) Derivados Sintéticos.

Generalidades.

En realidad este grupo comprende una serie de medicamentos de reciente introducción al mercado que se encuentran entre los narcóticos y los no narcóticos por tener características de ambos, sin embargo son muy útiles cuando se busca analgesia por lapsos cortos de tiempo, entre ellos se en-

cuentran los siguientes:

- 1) Etoheptazina.- Este compuesto generalmente se utiliza asociado al meprobamato y al A.A.S. con objeto de lograr una triple acción: bloquear los impulsos dolorosos, relajar la tensión muscular y aliviar la ansiedad. Se indica en dosis de dos tabletas 3 a 4 veces al día. Tiene el inconveniente de producir depresión del nivel de alerta, disnea, náusea o vómito.
- 2) Pentazocina.- Se trata de un analgésico muy potente, con efecto semejante al de la codeína, pero que tiene la desventaja de producir hipertensión arterial, diaforesis, mareo, cefalea, náusea, depresión respiratoria y con el uso prolongado puede ocasionar dependencia física.
- 3) Propoxifeno.- Su uso se había extendido como un buen analgésico sobre todo asociado a otros compuestos, sin embargo en la actualidad se ha demostrado que su potencia es difícil de distinguir de los placebos.
- 4) Tilidina.- El poder analgésico de este producto es similar al de la meperidina, sin embargo entre sus efectos colaterales se encuentran mareo, náusea y somnolencia, por lo que no es recomendable en pacientes ambulatorios en odontología.
- 5) Floctafenina.- Tiene una potencia analgésica 28 veces superior a la del A.A.S., actúa rápidamente mediante la inhibición de las prostaglandinas activadoras del fenómeno doloroso y en dosis de 3 a 4 comprimidos diarios, sólo ocasionalmente produce malestar gástrico, náusea o vómito.
- 6) Nefopam.- Este analgésico no narcótico se dice que tiene una potencia analgésica comparable a la de la morfina en rapidez, profundidad y en duración, con la ventaja de ser bien tolerado y de no producir depresión del nivel de alerta, sin embargo produce en ocasiones náusea, mareo, nerviosismo, y sequedad de boca. Se presenta en tabletas y ampollitas y se utiliza cada 6 a 8 horas.
- 7) Acido Mefenámico.- Se trata de un analgésico antipirético y antiinflamatorio sin efecto hipnótico y con una potencia superior al A.A.S., semejante a la combinación de éste último con codeína y fenacetina. En casos de sensibilidad especial se ha reportado diarrea con el uso del medicamento. Se presenta en tabletas y en suspensión y se utiliza en dosis de 4 a 5 tabletas al día ó 10 mg/kg de peso cada 6 horas.

ANALGESICOS NARCOTICOS.

De manera ideal, los narcóticos deberían mitigar el dolor actuando sobre un estado patológico específico. Si no se dispone de la terapéutica farmacológica específica -o durante el intervalo entre el comienzo de la terapéutica y el control efectivo- a menudo es necesario dar medicamentos contra el dolor mismo más que contra la enfermedad fundamental.

En esta sección se estudian los analgésicos narcóticos o simplemente narcóticos. A dosis terapéuticas, estos medicamentos mitigan el dolor sin causar depresión general del S.N.C. como lo hacen los anestésicos generales. A dosis mayores, los narcóticos son depresores más generales y todos tienen el peligro del abuso o la adicción.

Los analgésicos narcóticos naturales pueden ser usados como tales o modi-

ficados químicamente para formar los múltiples opiáceos semisintéticos. Además se han preparado compuestos puramente sintéticos que tienen propiedades semejantes a las que necesitan las sustancias naturales.

La clasificación química sirve para identificar el gran número de medicamentos existentes, antes de estudiar sus efectos biológicos. La clasificación química no se correlaciona bien con la clasificación farmacológica más útil, basada en la intensidad del dolor que puede ser aliviada por el narcótico, - propiedad que está íntimamente correlacionada con el riesgo de la adicción. El efecto farmacológico esencial de los analgésicos fuertes es el de mitigar el dolor después de administrar dosis tan pequeñas que no causan depresión en el S.N.C. con sedación, depresión respiratoria u otros resultados incapacitantes.

El dolor no es el resultado de un proceso neurofisiológico preciso, sino la - interpretación altamente subjetiva de ciertos estímulos sensoriales por un individuo específico en una situación dada. Se dice usualmente que el dolor afecta 2 componentes: la sensación que llega al S.N.C. y la percepción del estímulo -esto es, la elaboración (psíquica) y la reacción individuales-. - La morfina altera el segundo de estos procesos, de manera que el paciente puede reportar que el dolor todavía está presente, pero menos penoso. La naturaleza subjetiva del dolor introduce problemas intrincados en la evaluación de la efectividad de los medicamentos analgésicos. La evaluación se puede llevar a cabo sólo en sujetos humanos que sufren de dolor real, - es decir, que se presenta patológica o espontáneamente, y no en una preparación de laboratorio ni aún en personas con dolor experimentalmente provocado.

Los analgésicos narcóticos alivian el dolor casi independientemente de su - origen o intensidad. De hecho mientras más intenso es el dolor, más fácil es demostrar la efectividad del medicamento.

La tos es suprimida por los analgésicos narcóticos y ésta es la única - - acción que puede ser separada de la potencia analgésica de estos medicamentos.

PROPOXIFENO. (Darvon).

Ha sido imposible demostrar un efecto analgésico importante del propoxifeno, sin embargo, durante un número de años él (sólo en combinación con aspirina compuesta -codispril-) ha sido el medicamento más recetado en los - - E.U.A. Si es virtualmente inactivo para su propósito primario, todavía es una causa importante de muertes por suicidio o accidentales. En el mejor de los casos es un narcótico débil, pero se sugiere su uso para tratar los - síntomas de abstinencia de la heroína y aún como sustituto de la metadona para mantener a los que abusan compulsivamente de la heroína, La pretensión de que el propoxifeno es equivalente en potencia a la codeína no ha sido verificada en los ensayos clínicos. Obviamente, el Darvon - Compound debe ser comparado con la aspirina compuesta, así como la codeína y el A.A.S., para establecer su potencia relativa. El efecto analgésico de 32 mg de propoxifeno no es mayor que el de la aspirina compuesta. El - propoxifeno en dosis de 65 mg puede tener un efecto un poco mayor que el

de la aspirina compuesta con la cual se mezcla, pero el efecto es cuantitativamente tan pequeño que no todos los ensayos pueden establecerlo. La respuesta subjetiva favorable de algunos pacientes, con dolor o sin el, puede ser debida a una euforia ligera asociada con el efecto estimulante del S.N.C.

Comentarios.

El alivio del dolor es el prototipo de una respuesta subjetiva a un medicamento cuya evaluación clínica es difícil. No hay duda acerca de la efectividad de los agentes familiares, pero el problema de la evaluación clínica se vuelve importante y difícil cuando se deben hacer comparaciones entre los medicamentos existentes; cuando se deben evaluar nuevos compuestos; cuando se necesita información precisa acerca de la dosis; o cuando se estudia la naturaleza del dolor.

La naturaleza subjetiva del dolor puesta de relieve anteriormente, se vuelve aún más clara cuando se estudia la acción de los medicamentos sobre el dolor. La naturaleza del dolor que acompaña a una enfermedad particular se puede describir con bastante exactitud (calidad, irradiación, etc.) y se pueden definir el estímulo y las vías aferentes, ninguno de estos factores ni el umbral de percepción de un estímulo particular, sin embargo, dan una definición adecuada del dolor, puesto que no consideran los factores subjetivos que alteran la reacción individual. El dolor se origina no sólo en la sensación original, sino también en el significado que el individuo agrega al estímulo. La significación de este se demuestra por estudios comparativos sobre la cantidad del medicamento analgésico que necesitan pacientes, -- grosso modo, lesiones comparables en 2 situaciones diferentes. El civil -- amenazado por las consecuencias del accidente sufre más dolor y requiere más morfina que el soldado cuya lesión casi idéntica puede significar que lo releven del deber de combatir. Los analgésicos narcóticos alteran la angustia engendrada con la anticipación del dolor y otros factores que constituyen la "elaboración psíquica" de la sensación original.

Debido a la naturaleza subjetiva del dolor, es inverosímil que cualquier dolor que se pueda inducir experimentalmente en el laboratorio o en el hombre tenga valor significativo para la evaluación clínica de los analgésicos. Las técnicas comunes para medir la alteración de la respuesta al dolor en los animales implican la medición de la intensidad de una respuesta refleja iniciada por un estímulo que se presume que es doloroso. Por ejemplo, una fuente de calor puede ser enfocada sobre la cola de un roedor (ennegrecida para que absorba calor) y ser medido el tiempo hasta que se presenta la respuesta (latigazo de la cola). Esta respuesta es un reflejo espinal -- que todavía puede ser modificada por los medicamentos en el animal espinal. El dolor experimental se puede producir en el hombre por estimulación con calor, presión, electricidad o isquemia. Esto es equivalente a medir con el umbral del dolor, el cual no sólo es inconstante en diferentes sujetos o en diferentes momentos en el mismo sujeto, sino que también no guarda ninguna relación fidedigna con las acciones clínicas de los analgésicos. En consecuencia, el consenso actual es que el dolor se puede estudiar y los

medicamentos analgésicos se pueden ensayar solamente en el individuo que experimente dolor de origen patológico o espontáneo -esto es, el dolor no experimentalmente inducido-. El grupo disponible de pacientes en número -suficiente que experimentan dolor generalmente comparable en el de los que sufren el dolor postoperatorio o incisional.

Se debe incluir una comparación del medicamento en estudio ya sea con un placebo o con un analgésico estándar, y los pacientes se deben distribuir -aleatoriamente en los grupos o determinar al azar el orden de administración del medicamento. La técnica doblemente a ciegas debe, por supuesto, ser empleada. A intervalos antes y después de la administración del medicamento, el paciente es interrogado por un técnico desinteresado u otro observador acerca de la intensidad de su dolor y la presencia de efectos colaterales.

Cuando éstas respuestas subjetivas son convertidas en una escala descriptiva arbitraria y los datos apropiadamente organizados, es posible obtener -discriminación notablemente fina y reproducibilidad. No hay duda acerca de la aplicabilidad a la situación clínica puesto que las condiciones del ensayo constituyen simplemente la situación clínica organizada para permitir --observaciones cuantitativas controladas.

BIBLIOGRAFIA

- 1) DRILL, VICTOR A.
FARMACOLOGIA MEDICA
PRIMERA EDICION, 1974
EDITORIAL PRENSA MEDICA MEXICANA
- 2) GOODMAN, LOUIS S.
GILMAN, ALFRED
BASES FARMACOLOGICAS DE LA TERAPEUTICA
QUINTA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 3) GOTH, ANDRES
FARMACOLOGIA MEDICA
OCTAVA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 4) MEYERS, FREDERIK H.
MANUAL DE FARMACOLOGIA CLINICA
TERCERA EDICION 1977
EDITORIAL EL MANUAL MODERNO
- 5) SECRETARIA DE SALUBRIDAD Y ASISTENCIA
CUADRO BASICO DE MEDICAMENTOS
DEL SECTOR PUBLICO,
MEXICO 1979.

UNIDAD V

RELAJANTES MUSCULARES

Generalidades.

Los relajantes musculares actúan sobre neuronas internunciales de la médula deprimiendo vías polisinápticas. Estos relajantes musculares de acción central también actúan sobre centros altos y suelen emplearse contra la ansiedad. Experimentalmente estas drogas pueden deprimir la médula espinal en dosis que no causan sueño ni anestesia, en clínica resulta difícil saber cuál es la parte de su poder relajante muscular consecuencia de efectos -- contra la ansiedad. Aunque algunos medicamentos de esta serie se anuncian como relajantes musculares de acción central, otros con estructura casi idéntica se emplean mucho por su acción contra la ansiedad.

Todos los relajantes musculares muestran en algún grado efecto sedativo. - Los ensayos de laboratorio y las pruebas clínicas indican que en algunos de estos fármacos el efecto sedativo predomina sobre la actividad específica de relajación muscular. Esto ha creado alguna confusión en la clasificación de estas sustancias; la impropia clasificación, a su vez, ha hecho borrosa la distinción entre los dos efectos farmacológicos, y algunos agentes se han anunciado para ambos usos. Entre los que combinan acción sedante - destacada con propiedades relajantes musculares se encuentran algunos de los agentes ansiolíticos: meprobamato, tibamato, cloromezanona y diazepam. Los fármacos utilizados principalmente por sus propiedades relajantes musculares centrales son: metocarbamol, citrato de orfenadrina, carisoprodol, carbamato de clorofenecina, cloro-zoxazona, mefenesina, metaxalona.

Indicaciones.

- a) Espasmos musculares
- b) Resultantes de esguinces
- c) Artritis
- d) Miosis
- e) Fibrosis

Contraindicaciones.

Cuando no aparezca ninguna de las indicaciones dadas anteriormente.

Efectos secundarios.

- a) Somnolencia
- b) Vértigos
- c) Cefalalgia

- d) Visión borrosa
- e) Debilidad
- f) Letargo
- g) Ataxia
- h) Nistagmo

También se observan náuseas, vómitos, pirosis y molestias abdominales, - especialmente después de dosis bucales grandes. Las reacciones de hipersensibilidad incluyen erupciones dérmicas y prurito, y en casos raros, reacciones anafilactoides y leucopenia.

DERIVADOS DEL PROPANEDIOL

Generalidades.

MEFENESINA

Se encontró que era el compuesto (3-0-toliloxi-1-2 propnediol) más potente; y ha llegado a ser el prototipo de los relajantes del músculo esquelético. Es un sólido blanco cristalino, inodoro, de sabor amargo. Es poco soluble en agua y libremente soluble en etanol, propilenglicol y en las soluciones acuosas de urea. Las soluciones de mefenesina son estables y pueden esteronezarse por el calor.

La relajación muscular producida por la mefenesina no puede ser medida por una interferencia con la transmisión neuromuscular. Así que la acción relajante muscular de la mefenesina debe ser resultado de una acción central.

El examen de los efectos de la mefenesina en la función del sistema nervioso central muestra que esta droga deprimirá selectivamente tanto los reflejos flexor como extensor cruzado, mientras que respeta el reflejo patelar. - La mefenesina bloqueará tanto la facilitación como la inhibición central - del reflejo patelar, ya sea producida por la corteza, los ganglios basales, - el cerebelo o la formación reticular. También bloqueará el reflejo linguo--mandibular (apertura de la mandíbula) cuyas conexiones centrales son enteramente bulbares.

Indicaciones.

Se ha usado la mefenesina en una amplia variedad de enfermedades musculoesqueléticas y neuromusculares con el objeto de aliviar el espasmo muscular doloroso y la espasticidad. Teóricamente, la mefenesina debe ser de valor en el espasmo muscular (una contracción muscular involuntaria, - dolorosa y transitoria de origen traumático) y posiblemente en la espasticidad (una respuesta hiperactiva al estiramiento con pérdida de la gradación central). Debe ser posible disminuir el espasmo muscular mediante la depresión de las vías polisinápticas, una acción que posee la mefenesina, - Sin embargo su rendimiento clínico ha sido insatisfactorio. La administración oral es incapaz de producir una relajación muscular adecuada y las in-

yecciones intravenosas en el mejor de los casos proporcionan sólo un alivio transitorio.

Contraindicaciones.

El empleo crónico de la mefenesina son principalmente extensiones de sus acciones sobre el sistema nervioso central. Hay quejas de vértigo, laxitud y debilidad muscular poco intensas. La administración intravenosa es acompañada ocasionalmente por perturbaciones visuales y auditivas con algo de ataxia. La sobredosificación grave puede llevar hasta la parálisis total.

Dosis y vías de administración.

La mefenesina se encuentra en el mercado bajo una diversidad de nombres comerciales. Se encuentra disponible en tabletas de 0.5 g y en forma de un elixir con sabor agradable. Se administra en una dosis de 1 a 3 gramos repetida tre a cinco veces al día. Vía de administración oral.

CARBAMATO DE MEFENESINA

Este compuesto fue sintetizado en un intento de prolongar la actividad de la mefenesina. Uno de los grupos hidróxilo de la mefenesina fue protegido de la esterificación con ácido carbámico, anticipando que la droga sería destoxificada menos rápidamente por conjugación con ácido láctico. Sin embargo, esta alteración en la estructura química ha producido poco o ningún cambio en la actividad farmacológica. El carbamato de mefenesina tiene un espectro de actividad farmacológica casi idéntico al de la mefenesina y los dos compuestos son depresores equipotentes de la actividad refleja a niveles plasmáticos equimolares.

Preparaciones y dosis.

El carbamato de mefenesina se encuentra en el mercado con el nombre comercial de Tolseram, en tabletas de 0,5 g o en forma de una suspensión con sabor agradable que proporciona 1 g en 5 ml. Se administra en dosis de 2 ó 3 g repetidas tres a cinco veces al día.

METOCARBAMOL

Este compuesto difiere del carbamato de mefenesina porque tiene un grupo metoxilo insertando en el anillo fenólico, en lugar de un grupo metilo. Químicamente es el monocarbamato de 3-(o-metoxi-fenoxi)-1,2-propanediol. Esta ligera modificación en estructura ha producido solamente un cambio moderado en la actividad. Como la mefenesina, el metocarbamol deprime selectivamente los reflejos polisinápticos y puede producir parálisis total. Como antagonista de la estricnina, el metocarbamol tiene una potencia similar a la del carbamato de mefenesina, pero la duración del antagonismo es mayor. Es un antagonismo más activo del pentilentetrazol y de las con-

convulsiones máximas por electrochoque que el carbamato de mefenesina.

Los niveles sanguíneos obtenidos con metocarbamol son ligeramente más altos y de duración más larga que con el carbamato de mefenesina. También hay datos de que el metocarbamol tiene menos acción hemolítica que la mefenesina y como es más soluble en agua que la mefenesina o el carbamato de mefenesina, resulta apropiado para la administración intravenosa.

El metocarbamol es excretado sin cambio o en forma de un conjugado glucorónico. Debe hacerse notar que tanto el metocarbamol como el carbamato de mefenesina causan una prueba falsa positiva para el ácido 5-hidroxiindolacético urinario y por tanto debe evitarse su uso cuando se busque en un paciente un posible tumor carcinóide.

MEPROBAMATO

Es el éster dicarbamato del 1,3-propanediol con un grupo metilo y un grupo n-propilo insertados en la posición dos.

Aunque este compuesto se conoce principalmente por su acción tranquilizante es un análogo de la mefenesina con propiedades relajantes musculares definidas.

El meprobamato, al igual que la mefenesina, bloqueará selectivamente los reflejos polisinápticos y producirá parálisis completa con dosis altas. Es eficaz contra las convulsiones por electrochoque y contra las convulsiones audiológicas. El meprobamato produce una depresión selectiva de la actividad talámica sin deprimir el sistema reticular activante o la corteza. La característica más prominente que distingue al meprobamato de la mefenesina es su mayor potencia de acción en los niveles más altos del sistema nervioso central.

El meprobamato tiene pocos efectos colaterales serios. Produce mayor somnolencia que la mefenesina y potencia a otros depresores como el alcohol y los barbituratos. Se han informado pocos casos de dependencia a la droga producidos por la administración crónica; así que deben tenerse precauciones en la terapéutica a largo plazo con dosis grandes en pacientes con personalidades inestables.

Debe evitarse la supresión súbita después de una terapéutica a largo plazo con grandes dosis, ya que en la literatura existen datos de convulsiones del tipo de gran mal después de la suspensión súbita. Dosis excesivamente grandes, tomadas usualmente con intento suicida, pueden causar coma, choque y colapso respiratorio; el tratamiento es principalmente sintomático.

Preparaciones y dosis.

El meprobamato se presenta en tabletas de 200 y 400 mg y como una suspen

sión con sabor agradable que contiene 200 mg en 5 ml de líquido. La dosis usual es de 400 mg repetidos 3 ó 4 veces al día. En el espasmo muscular grave se han dado dosis tan altas como 2 400 mg por día.

CARISOPRODOL

Es derivado del meprobamato se prepara insertando un grupo isopropilo en uno de los grupos carbamato. El carisoprodol es incapaz de bloquear las convulsiones por pentilentetrazol. También es extraordinariamente activo para abolir la rigidez de descerebración.

El carisoprodol es inactivo como analgésico cuando se prueba por los métodos farmacológicos usuales, pero alivia el dolor de la inflamación articular producido por la inyección local de nitrato de plata. También posee una actividad antipirética débil. Es bien absorbido por vía oral y su velocidad de desaparición del torrente sanguíneo es semejante al del meprobamato. Una gran proporción de la droga es excretada sin cambio alguno. Existen pocas pruebas clínicas de que el carisoprodol cause algún alivio del dolor que no sea secundario a su acción relajante muscular.

Los efectos colaterales hasta ahora consecutivos a la terapéutica con carisoprodol son quejas poco frecuentes de somnolencia, laxitud y debilidad.

Dosis

El carisoprodol (Soma) se encuentra disponible en tabletas de 350 mg y en cápsulas de 250 mg. La dosis usual en el adulto es de 350 mg repetidos tres veces al día.

Comentarios.

Todos los medicamentos antes descritos se emplean ampliamente para aliviar los espasmos y la espasticidad que acompañan a enfermedades o lesiones de músculos, huesos y articulaciones.

Aunque estos medicamentos se ofrecen entendiéndose que son relajantes musculares bastante específicos, los clínicos investigadores cada vez tienen más netamente la impresión de que actúan simplemente como sedantes, sobre todo administrados por la boca. Los barbitúricos también pueden reducir el espasmo muscular. Incluso los placebos tienen una acción neta sobre los dolores y las molestias que se dice se benefician con el tratamiento con relajantes musculares.

En general, la eficacia clínica de las drogas relajantes musculares no ha sido impresionante. Sin embargo, estos compuestos son empleados frecuentemente debido a la gran necesidad de un alivio aunque sea pequeño en pacientes que sufren del impedimento motor y del dolor del espasmo y de la espasticidad musculares.

BIBLIOGRAFIA

- 1) DRILL, VICTOR A.
FARMACOLOGIA MEDICA
PRIMERA EDICION, 1974
EDITORIAL PRENSA MEDICA MEXICANA
- 2) GOODMAN, LOUIS S.
GILMAN, ALFRED
BASES FARMACOLOGICAS DE LA TERAPEUTICA
QUINTA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 3) GOTH, ANDRES
FARMACOLOGIA MEDICA
OCTAVA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 4) MEYERS, FREDERIK H.
MANUAL DE FARMACOLOGIA CLINICA
TERCERA EDICION 1977
EDITORIAL EL MANUAL MODERNO
- 5) SECRETARIA DE SALUBRIDAD Y ASISTENCIA
CUADRO BASICO DE MEDICAMENTOS DEL
SECTOR PUBLICO.
MEXICO 1979.

UNIDAD VI

SEDANTES

Generalidades.

Los medicamentos sedantes hipnóticos tienen propiedades farmacológicas bastante semejantes a las de los anestésicos generales. Cuando se usan grandes dosis, como en los intentos de suicidio o cuando un barbiturato como el tiopental se emplea para inducir anestesia general, desaparece la diferencia entre un sedante hipnótico y un anestésico general.

Los sedantes hipnóticos son sustancias sólidas o líquidas que causan depresión generalizada del S.N.C. durante un período más prolongado que los gases que se exhalan rápidamente. Así, ellos son más convenientemente compuestos y más adecuados para administración oral con el fin de inducir el sueño o mitigar la angustia.

La clase de medicamentos sedantes han sido usados para mitigar la angustia y para inducir el sueño desde 1903 aproximadamente. Después de 1950, los tranquilizadores antipsicóticos fueron reconocidos como una clase separada de medicamentos y su empleo revolucionó la práctica institucional de la psiquiatría. El médico, en la práctica no institucional, que trata regularmente con pacientes angustiados más que con psicóticos, creyó que éste importante progreso debería tener también un impacto en su práctica privada. Sin embargo, cuando los resultados fueron desalentadores. En este punto, el médico debería haber concluido que un medicamento de la clase de los sedantes hipnóticos y no un tranquilizador era el indicado (como en el pasado) para este grupo de pacientes. Pero le fue ofrecida una serie de medicamentos sedantes anunciados como "tranquilizadores", "tranquilizadores menores", "sucedáneos de los tranquilizadores", etc. Entonces el médico adoptó uno de estos sedantes mal membretados y concluyó que era el "único tranquilizador que le daba resultado".

El reconocimiento del hecho de que el meprobamato era meramente una variante cara de un sedante de acción intermedia requirió de 10 años. La influencia de la propaganda y las ambigüedades en el uso del término "tranquilizador" continúa confundiendo en relación con algunos sedantes recientemente introducidos, especialmente con el diacepam (Valium).

El cuadro que se muestra a continuación es la comparación de las acciones que diferencian a los sedantes de los tranquilizadores.

Sedantes (por ejemplo, barbituratos, meprobamato, alcohol).	Tranquilizadores (por ejemplo, fenitoacinas, reserpinas)
<p>Con dosis crecientes:</p> <p>Alivio de la angustia.</p> <p>Sedación.</p> <p>Ataxia.</p> <p>Excitación, embriaguez, desinhibición.</p> <p>Anestesia.</p> <p>Depresión respiratoria y vasomotora y muerte.</p> <p>Con administración continuada:</p> <p>Acción anticonvulsiva.</p> <p>Dependencia física (síndrome de abstinencia).</p> <p>Hábito</p> <p>Relajación de la musculatura voluntaria</p>	<p>Control de la conducta psicótica.</p> <p>Despertar fácil.</p> <p>Signos extrapiramidales: parkinsonismo, distonías.</p> <p>Efectos autónomos (atropinoides, simpaticoplejicos).</p>

Cada uno de los medicamentos mencionados en este capítulo como sedante hipnótico produce, si se da en dosis progresivamente mayores, sedación, - excitación o desinhibición, hipnosis, anestesia general y en último término depresión bulbar con muerte. Con la administración repetida o continua, - los sedantes son anticonvulsivos habituales, causan síndrome de abstinencia y son depresores de la médula espinal. En contraste, los tranquilizadores no causan anestesia general, esto es, el paciente puede ser despertado aún después de dosis enormes. Ellos tienen acción convulsionante, no producen hábito y su utilidad terapéutica se encuentra en el tratamiento de los pacientes psicóticos y no de los angustiados.

La clasificación más útil de los sedantes hipnóticos se basa en la persistencia de su acción. Sin embargo, hay ventajas en comenzar con una clasificación química. La más importante de estas ventajas es poder predecir la clasificación dentro del grupo de los sedantes. Como primera aproximación se puede esperar que la modificación más reciente de un barbiturato, - de un uretano o de un alcohol actúan de manera bastante semejante a los otros medicamentos de cada una de las clases.

Los barbitúricos de acción ultracorta usados como anestésicos generales son intrínsecamente lipófilos en extremo y también existen en las mismas formas tautómeras que los oxibarbitúricos. Después de inyectados, ellos son rápidamente concentrados en el encéfalo debido a su gran contenido lipídico y vascularización, alcanzando una concentración máxima de 1 minuto. Los barbitúricos de acción prolongada sólo son distribuidos lentamente en el encéfalo porque están parcialmente ionizados al pH del cuerpo, esto es, en el plasma,

Los barbitúricos de acción corta e intermedia tienen propiedades entre aquellas de los tiobarbitúricos y las del fenobarbital. Ellos son enteramente metabolizados en el hígado.

Indicaciones.

- 1) Introducción del sueño.- Hay algunas situaciones en las que el médico puede prever la necesidad de medicación a la hora de dormir. Es considerado, por ejemplo, ofrecer sedación a un paciente que intente dormir en el ambiente extraño de un hospital o a una persona que ha pasado un día que engendra angustia. Sin embargo, la indicación para los medicamentos inductores de sueño, usualmente se establece por la queja de un paciente que está insatisfecho con el patrón de su sueño. La naturaleza de esta queja es el factor importante para determinar el medicamento que se elija usar.

Unos cuantos pacientes, debido a su angustia u otras razones, tienen dificultad para dormir, pero una vez dormidos ya no la tienen. Para tales pacientes es adecuado un hipnótico que actúe rápidamente con una persistencia breve de acción. Otros individuos no tienen dificultad para dormirse, pero despiertan después de pocas horas para pasar inquietos la noche y se levantan sin haber descansado. Otros tienen ambos problemas. En estos individuos se puede usar un medicamento de acción intermedia con el riesgo inherente de una "cruda"; o se prescribe un medicamento de acción corta a la hora de acostarse con instrucciones de repetirlo si es necesario.

- 2) Mitigación de la angustia: Sedación.

a) Angustia Circunstancial.- La angustia puede ser una reacción apropiada frente a varias circunstancias. Si la situación no se presenta con demasiada regularidad, se puede usar un barbitúrico u otro sedante por breves períodos de tiempo para reducir al mínimo la angustia. Muchas personas usan el alcohol de esta manera y los riesgos que acompañan al uso de otros sedantes son similares. Puede ocurrir que se mitigue la angustia, pero con una disminución correspondiente de la habilidad manual y del juicio. En algunas situaciones (por ejemplo, un examen escolar crítico), la sedación puede menoscabar la ejecución aunque el sujeto esté engañado por la euforia, creyendo que la ha hecho bien. Hay, sin embargo, situaciones en las que a sedación ligera puede mejorar tanto la ejecución como el talante.

- b) Medicación antes de un procedimiento.- La previsión y la experiencia de un procedimiento médico doloroso o temible o de una manipulación odontológica es un caso especial de angustia debida a una situación. La dificultad estriba en que el paciente debe cooperar y no permanecer indebidamente angustiado aún cuando el procedimiento implique dolor u otro estímulo temible. Los medicamentos sedantes solos pueden ser satisfactorios, pero las dosis ordinarias dadas a un paciente descansado pero con angustia durante el día tienen poco efecto. Si se aumenta la dosis de un barbitúrico o cualquier otro sedante, el riesgo de excitarse con el dolor aumenta y se debe tener en cuenta el efecto sobre la con-

ducta en un paciente externo. La combinación de un tranquilizador fenotiacínico y de una dosis pequeña de un analgésico narcótico -por ejemplo, medias dosis de meperidina y prometacina intramuscularmente- es una alternativa que se aplica a menudo en situaciones en las que se recurre a la medicación antes del procedimiento.

- c) Angustia neurótica.- La angustia circunstancial es una angustia generada por una situación externa temible o amenazadora, inmediatamente presente. La angustia neurótica es una angustia en respuesta a un estímulo ambiental insuficiente o a ningún estímulo adecuado aparente.

La angustia neurótica se puede manifestar como temor subjetivo o tensión, como cualquiera de diversos trastornos psicofisiológicos; como conducta obsesiva o fóbica; o como depresión. De un grupo no seleccionado de pacientes ambulatorios, probablemente más de la mitad habrán solicitado ayuda a causa de sus dolencias relacionadas con la angustia.

Los sedantes hipnóticos a menudo dan alivio sintomático parcial de la angustia y disminuyen la intensidad de los síntomas orgánicos asociados. Ciertamente no se deben usar medicamentos para excluir psicoterapia y los riesgos ocasionales inherentes a su uso deben tenerse presentes.

Hay pocas estimaciones objetivas de los resultados del tratamiento con sedantes únicamente. Sin embargo, los informes subjetivos del paciente y las evaluaciones de los médicos en condiciones cuidadosamente controladas, han establecido la efectividad de cada uno de los medicamentos clasificados en este capítulo como sedantes.

Los sedantes de acción prolongada -el fenobarbital es el estándar de referencia- son preferibles a los medicamentos de acción corta o intermedia para aliviar la angustia. Si se usan las preparaciones de acción corta, el efecto aparece rápidamente y decae rápidamente.

- 3) Excitación debida a medicamentos o enfermedad.- Los sedantes hipnóticos se pueden emplear para reducir la excitación asociada con el hipertiroidismo o para contrarrestar los efectos estimulantes de la efedrina en un paciente asmático.
- 4) Reducción de la actividad espontánea.- El reposo forzado en cama se puede hacer más tolerable por la sedación. La excitación marcada no se puede controlar con sedantes o dosis menores que las anestésicas. En la excitación maníaca está indicado ahora el uso de un tranquilizador fenotiacínico.

Contraindicaciones,

Un paciente con antecedentes de una reacción alérgica a uno de los sedantes debe recibir un sedante de un tipo químico diferente. La porfiria o una historia familiar de porfiria contraindican el uso de los barbitúricos.

En presencia de insuficiencia hepática o renal, los sedantes se deben recetar en dosis iniciales pequeñas considerando la biotransformación y excreción más lentas. En realidad, los pacientes de cirrosis con ascitis y marcada retención de B.S.F. (Bromosulfaleína) no muestran ni sedación prolongada ni concentraciones sanguíneas elevadas después de la adminis-

tración de barbitúricos de corta acción. Evidentemente, el daño hepático - debe ser masivo antes de que la precaución se vuelva importante.

Los efectos de los sedantes son aditivos entre sí. Puesto que el alcohol es usado tan comunmente, sus efectos a menudo se agregan tanto al de los sedantes prescritos como al de los obtenidos ilegalmente. El mal uso de un sedante - comunmente un barbiturato o diacepam- combinado con alcohol puede dar por resultado un conductor seriamente intoxicado con un nivel sanguíneo de alcohol menor que el aceptado para definir una intoxicación en el sentido legal. La dosis letal de un barbitúrico es mucho menor después de la ingestión de alcohol - o sea, que al evaluar el estado de un paciente que ha intentado suicidarse, se debe considerar la cantidad total del depresor tomado-.

Efectos secundarios.

Los efectos indeseables comunes a todos los medicamentos sedantes hipnóticos enumerados en este capítulo serán descritos aquí.

I. Efectos colaterales e intoxicación crónica.

1. Somnolencia.- Todos los sedantes enumerados en este capítulo producen somnolencia se dan en suficiente cantidad y algunos pacientes se vuelven somnolientos aún con pequeñas dosis. Que la somnolencia sea considerada o no como un efecto indeseable depende de lo que espere el médico, de la personalidad del paciente y de las necesidades y expectativas de éste de la terapéutica. Para algunos pacientes, la sensación de que está siendo abatido puede ser amenazadora; para otros, esta y la mitigación asociada de la angustia son bienvenidas.

2. Ejecución y juicio defectuosos.- Una persona no necesita estar cayéndose de beoda antes de que su ejecución motora y, probablemente más importante, de que su juicio estén significativamente deteriorados. El agente nocivo más común a este respecto es el alcohol. En este momento se debe hacer hincapié en que todos los sedantes son equivalentes al alcohol en todos sus efectos; que todos sus efectos se suman a los del alcohol; y que éstos persisten más de lo que se podría predecir.

3. Cruda.- El efecto de los sedantes se puede extender más allá de un período que el paciente juzga deseable. Después de una dosis a la hora de acostarse, de un sedante aún de corta acción, el paciente se puede quejar a la mañana siguiente de sentirse mareado, letárgico o agotado. Los agentes de acción prolongada ocasionan más trastornos de este tipo,

4. Abuso de los medicamentos o habituación a ellos.- De ningún otro sedante (o de cualquier medicamento) se abusa tan extensamente y con tan gran daño social e individual como del alcohol. Sin embargo, de cada uno de los agentes terapéuticos y varios de los tóxicos -por ejemplo, gasolina, freones- mencionados antes se ha abusado a causa de la euforia y supresión de la angustia que proporcionan.

Los medicamentos de acción corta o intermedia son más propensos a ser mal usados debido al rápido inicio y a la intensidad de su efecto. Fumar -

una droga como la marihuana o inhalar un hidrocarburo ofrecen la misma ventaja y hasta en mayor grado, debido a la rápida absorción de los componentes activos a través de la membrana alveolar.

Con excepción del alcohol y algunos de los hidrocarburos, ninguno de los sedantes comunmente usados causa intoxicación crónica distinta a la sedación, ebriedad y la posibilidad de un síndrome de abstinencia.

5. Síndrome de abstinencia.- Los síntomas de abstinencia después del abuso de un sedante de acción corta o intermedia aparecen en 18-24 horas y aumenta al máximo en 2-3 días. Cuando se retiran el fenobarbital, el clordiazepóxido o un depresor similar de acción prolongada, los síntomas pueden no aparecer en una semana.

II. Intoxicación aguda debida a dosis excesivas.

Las grandes dosis de hipnóticos producen un estado de anestesia profunda, prolongada. La respiración está deprimida. Si se llega a una etapa de depresión bulbar grave, se presenta choque respiratorio. Los reflejos tendinosos persisten hasta las etapas más profundas. El nistagmo se observa hasta que se alcanza el equivalente al plano 2 de la etapa III de la anestesia.

Dosis y vías de administración.

Al clasificar los sedantes en relación con su uso, la duración del efecto es la propiedad más importante. Como se explicó anteriormente, los sedantes de acción prolongada son preferibles a los de acción corta o intermedia en el tratamiento prolongado de la angustia. La dosis hipnótica se da a la hora de acostarse, a menudo con permiso para repetirla una vez antes de la 1.00 A.M. en caso necesario. Se prefiere la administración oral con el fin de inducir el sueño o mitigar la angustia.

Para la sedación, los medicamentos de acción prolongada, acumulativa, se dan 3-4 veces al día. En realidad, 2 dosis al día de un medicamento acumulativo como el fenobarbital o el clordiazepóxido dan, en pocos días, un nivel sanguíneo constante durante las 24 horas.

La dosis efectiva y tolerada varía con el individuo y se debe determinar para cada paciente. Las dosis se deben cambiar solo a intervalos de 3-4 días a menos que la primera resulte excesiva. A menudo se puede aumentar la dosis cuando el paciente se acostumbra al efecto. Como ejemplo, 15 mg 3-4 veces al día, es una dosis inicial común de fenobarbital. Una cuarta dosis diaria es usualmente tolerada y algunos pacientes pueden requerir y tolerar 30 mg 3-4 veces al día. Otros se pueden quejar de los efectos a menos que las dosis se reduzcan a 8 mg. Todavía otros pueden tomar las dosis del día además de 100 mg a la hora de acostarse, sin molestias.

Comentarios.

El estudio detallado del mecanismo de acción de los sedantes hipnóticos requeriría de la repetición de las teorías propuestas para la acción de los a--

nestésicos generales, sin más conclusiones definitivas. Los barbitúricos y los otros pocos sedantes que han sido estudiados son depresores selectivos del sistema reticular activador ascendente (SRA) y esta acción puede explicar la pérdida de la conciencia. Si se imponen 2 condiciones a los estudios bioquímicos sobre la acción de los barbitúricos -que se deben emplear concentraciones razonables y que el S.N.C. debe ser desusualmente sensible al efecto- todo el voluminoso trabajo puede llamarse exploratorio en el mejor de los casos.;

Se deben observar varias precauciones si la descripción de los efectos de los sedantes hipnóticos va a ser exacta, y válida la clasificación del medicamento. Este debe ser estudiado en una amplia gama de dosis si se va a observar la sucesión completa de los efectos descritos adelante -o, si diferentes medicamentos están siendo comparados, se deben usar dosis igualmente potentes antes de proclamar selectividad de efecto para cada uno - u otro medicamento- Además, muchos de los efectos por describir son -- subjetivos y pueden parecer, por lo tanto, que muchos de los efectos medicamentosos varían impredeciblemente. En realidad, los medicamentos mismos, que pueden actuar sólo sobre el sustrato orgánico de la conducta, - son bastante congruentes. Sin embargo, el contenido y la intensidad de la reacción están condicionados por factores individuales y el escenario en el cual se da el medicamento. Las variadas reacciones al alcohol en diferentes individuos y situaciones son ejemplos comunes de este hecho.

BENZODIACEPINAS

Generalidades.

A pesar del extendido uso de las benzodiazepinas se desconoce en gran parte la indicación específica de estos medicamentos. La mayoría de los médicos no psiquiatras los prescriben como calmantes, como hipnóticos o en trastornos psicógenos no bien extendidos ni diagnosticados; por ello, no extraña que los medicamentos más vendidos sean las benzodiazepinas, lo cual representa un problema en la farmacodependencia.

Es importante hacer notar que existen muchos medicamentos con capacidad tranquilizante (neurolepticos, antidepresores, antihistaminicos, etc.); pero este efecto es sólo secundario; la benzodiazepina tiene la capacidad tranquilizante como propiedad principal.

En relación con los demás tranquilizantes, las benzodiazepinas producen menos efectos colaterales, menos toxicidad y menos dependencia. Hasta el momento, no se ha podido clasificar adecuadamente a las benzodiazepinas según correspondan sus propiedades terapéuticas individuales, porque, como grupo, su espectro terapéutico es similar.

Las benzodiazepinas se diferencian de los otros psicofármacos por lo siguiente;

- Disminuyen la agresión en los animales, sin producir sedación. El resto de los tranquilizantes producen primero sedación,
- Reducen la capacidad del animal para mantener el condicionamiento aversivo,

- Tienen un efecto "desinhibidor".
- No poseen efectos antipsicóticos y antidepresores propiamente dichos.

Indicaciones.

Las principales indicaciones de las benzodiazepinas son:

- 1) En estados ansiosos con nerviosismo, aprensión y agitación; o en algunas manifestaciones somáticas de la ansiedad (como úlcera gástrica o colitis ulcerosa); o en crisis fóbica y/o de pánico (por vía intravenosa)
- 2) En trastornos musculares en que se presente un espasmo.
- 3) En epilepsia.
- 4) En síndrome de abstinencia por alcohol y otros tranquilizantes.
- 5) Como hipnótico.

Es importante hacer notar que no en todos los estados ansiosos o en todos los pacientes con insomnio se debe administrar un ansiolítico; por ejemplo, en estados nerviosos por esquizofrenia, la indicación es un neuroleptico; en ansiedad por depresión un antidepresivo.

Las benzodiazepinas son utilizadas como coadyuvantes en psicoterapia, durante las primeras entrevistas, para facilitar la comunicación y la disminución de la ansiedad.

Otra indicación importante es en la prevención de brotes psicóticos en pacientes que han sido sometidos a una operación abierta de corazón.

La eficacia ansiolítica de todos los tranquilizantes puede representarse así, de mayor a menor: Benzodiazepinas-meprobamato-barbitúricos-placebo.

Contraindicaciones.

La combinación con cualquier depresor del S.N.C. puede potenciar los efectos colaterales de las benzodiazepinas (¡Cuidado con el alcohol y con el manejo de vehículos u otra maquinaria que pueda lesionar al paciente!). En general, no se recomienda la combinación con neurolepticos salvo en contadas ocasiones. Las benzodiazepinas son fármacos que pueden desarrollar dependencia y tolerancia, por ello, es prudente administrarlos con precaución, sobre todo en aquellos pacientes que tienden a la farmacodependencia. En estos casos es mejor utilizar como tranquilizante un neuroleptico con propiedades sedantes.

Las benzodiazepinas no deben ser administradas por más de dos meses continuos.

La administración intramuscular no se recomienda, porque, produce muy bajos niveles en sangre, además, sus efectos terapéuticos son muy limitados. Debido a que estos medicamentos se excretan en la leche materna, se ha visto somnolencia y letargia en el lactante.

Las contraindicaciones más importantes son las siguientes:

- 1) Miastenia grave.
- 2) Todas las formas de ataxia.
- 3) Otros depresores del S.N.C.
- 4) Primer trimestre del embarazo.

- 5) Glaucoma (relativa).
- 6) Hipersensibilidad a las benzodiazepinas.
- 7) Estado de choque.

Efectos secundarios.

La mayoría de los efectos colaterales de las benzodiazepinas son la extensión de su espectro terapéutico; a saber; somnolencia, excitación psicomotriz, hipotensión arterial, mareo, vértigo, fiebre, trastornos gastrointestinales. También puede presentarse abatimiento general, apatía, trastornos de la concentración y trastornos articulares por flacidez muscular. Los efectos colaterales son más frecuentes en pacientes de edad avanzada y/o enfermedades debilitantes.

Se ha visto que el clordiazepóxido puede producir, en algunos pacientes ansiosos hostilidad y agresión a partir de la primera semana de tratamiento; - por su parte, el oxacepam no ocasiona tal trastorno. La capacidad de relajación muscular puede ser un efecto colateral muy molesto en pacientes - que no la necesitan. Estos efectos son reversibles al suspenderse el medicamento.

Intoxicación.

Debido a su baja capacidad para deprimir los centros bulbares implicados en la respiración y la estimulación cardíaca, las benzodiazepinas son medicamentos "a prueba de suicidio". El síntoma más importante en la intoxicación por benzodiazepinas es la depresión del S.N.C., que puede ser desde somnolencia hasta coma. Los efectos sobre la presión sanguínea, la frecuencia cardíaca y la respiración se encuentran sólo cuando se han tomado dosis extremadamente grandes.

Los síntomas más comunes que se presentan por una sobredosis de benzodiazepinas son: apatía, lentitud motora, flacidez muscular, diplopía, ataxia, mareo, náuseas y cefalea.

Dosis.

La dosis tiene que ser individualizada, ya que un paciente puede necesitar 10 veces más que otro. La toma principal debe administrarse por la noche, para que durante el día se presente un mínimo de sedación. El efecto terapéutico de las benzodiazepinas se puede observar después de una semana de tratamiento; no es tan prolongado como el de los neurolepticos o como el de los antidepresivos. Al inicio se deben administrar dosis bajas y luego aumentarlas paulatinamente, según las necesidades individuales. Cuando se quiera suspender la medicación, es necesario realizarlo poco a poco, sobre todo cuando el paciente ha tomado el medicamento por mucho tiempo, a fin de evitar estados confusionales y psicosis por supresión brusca. Debido a que sus efectos terapéuticos disminuyen después de cuatro semanas, se ha aplicado el tratamiento intermitente; una semana con medicamento, y otra libre.

Vías de administración.

Como ya se dijo anteriormente, se prefiere la administración oral con el fin de inducir el sueño o mitigar la angustia.

Clasificación de las benzodiacepinas.

Los nombres oficiales que a continuación aparecen, son derivados de las benzodiacepinas; aunque no se mencionarán todos, los descritos a continuación son los que se usan con mas frecuencia por los médicos (ver encuestas # 1).

GLOBAZAM (Urbadan)

Es el primer derivado benzodiacepínico con nitrógeno. Se ha considerado que posee algunas ventajas en relación con el diacepam y el clordiacepóxido, porque permite realizar tareas que requieren alguna precisión. Además se ha dicho que su capacidad ansiolítica se presenta antes que con el resto de las benzodiacepinas sin tener efecto hipnótico. Estos efectos deberán comprobarse en estudios clínicos más minuciosos.

El clobazám se ha utilizado, con buenos efectos, en síntomas de ansiedad psíquica y somática. Debido a que no interrumpe con la capacidad para ejecutar tareas de precisión, se ha considerado que no es peligroso (a dosis de 10 mg) para los pacientes que manejan vehículos. Esta afirmación debe ser tomada con reserva. En trastornos conductuales del niño y del anciano se han obtenido algunos éxitos con la aplicación de éste medicamento. - Hasta el momento no se ha observado farmacodependencia, pero quizá sólo sea cuestión de tiempo. Las dosis altas pueden producir somnolencia, dermatitis, obstipación (estreñimiento rebelde), estados confusionales, mareos y cefaleas.

Presentación.

Caja con 20 comprimidos de 10 mg.

Dosis

Para ambulantes; 10-30 mg/día (vía oral)

Para Internados; 30-60 mg/día (vía oral)

CLORDIACEPOXIDO (Librium)

Es un anticonvulsionante y relajante muscular. Entre otros tiene los efectos siguientes: Estimular el apetito, en grandes dosis produce hipotensión arterial y bradicardia. El efecto sobre la relajación muscular es mayor que la del meprobamato. En psicosis alcohólicas, se ha administrado en dosis de 50 a 600 mg por vía intravenosa, según algunos autores, es el medicamento de elección en ese caso. También se ha utilizado para aliviar trastornos psicósomáticos como cefalea tensional, trastornos gastrointestinales colon irritable y úlcera péptica; además produce mejoría en la ansiedad, la

agitación y la agresión. Se ha empleado, con resultados dudosos, para tratar trastornos conductuales del niño. Con dosis ligeramente superiores a las terapéuticas, pueden presentarse despersonalización, confusión, ansiedad y alteración en la percepción espacio-temporal. También se ha visto que con su aplicación se producen menorragias y disminución o aumento de la libido. Cuando se toma el medicamento en forma crónica, puede presentarse ataxia, insomnio o agitación. Como reacción paradójica, ocasionalmente se ha visto aumento de la irritabilidad y de la hostilidad. Los más altos niveles en sangre, después de una dosis oral, se presentan a las cuatro horas. La vida media es de 6 a 30 horas; en ancianos se prolonga hasta un 60 % más.

Presentación.

Frasco con 30 a 100 grageas de 5 mg.

Frasco con 25 o 100 grageas de 10 mg.

Frasco con 25 grageas de 25 mg.

100 mg = una ampollita (por vía intramuscular), una caja para uso por vía intravenosa; mezclar con 10 ml de agua bidestilada.

Dosis

Para ambulantes: 5-50 mg/día (vía oral).

Para internados: 20-120 mg/día (vía oral).

Intramuscular o intravenosa (en estados de pánico, agitación o delirio) no aplicar más de 600 mg en 24 hs.

DIACEPAM (diacepam, paxate, valium)

El diacepam es un medicamento de dos a tres veces más eficaz que el clordiacépoóxido y actúa principalmente sobre el sistema límbico (núcleo amigdalino, hipocampo y septum). Tiene gran valor para aliviar la ansiedad, la tensión, la inquietud, la excitación psicomotriz, las distimias, los trastornos somáticos de la ansiedad y la hipocondriasis. Como relajante muscular, se ha utilizado en casos de espasmo postraumático, esclerosis múltiple, disquinesia tardía y parkinsonismo. En crisis fóbricas o de pánico, es el medicamento de elección, en cuyos casos se debe administrar en dosis mínimas de 10 a 20 mg por vía intravenosa. Cuando se administra por vía oral, los niveles más altos en sangre se encuentran a las dos horas. La duración media de los efectos del diacepam es de 20 a 40 horas, de ahí que con este producto sea innecesario administrar al paciente más de dos tomas al día.

Por su eficacia, este medicamento es una de las drogas de elección de estatatus epiléptico.

Se ha empleado con éxito en el tratamiento del vaginismo (2 a 30 mg al día), conjuntamente con psicoterapia.

También se han obtenido buenos resultados en terrores nocturnos y como hipnótico.

Presentación

Díacepam

Caja con 20 tabletas de 2 mg.

Caja con 20 tabletas de 5 mg.

Caja con 20 tabletas de 10 mg.

Paxaté

Caja con 30 tabletas de 2 mg.

Caja con 30 tabletas de 5 mg.

Caja con 30 tabletas de 10 mg.

Valium

Frasco con 30 ó 100 comprimidos de 2 mg.

Frasco con 30 ó 100 comprimidos de 5 mg.

Frasco con 25 ó 100 comprimidos de 10 mg.

Vallum 10

10 mg = 2 ml, caja con 6 ó 50 ámpulas (por vía intravenosa o intramuscular).

Dosis:

Para ambulantes: 2-10 mg/día (vía oral)

Para internados: 10-40 mg/día (vía oral)

FLURACEPAM (Dalmadorm)

Es un compuesto que se metaboliza rápidamente, pero un metabolito activo permanece durante mucho tiempo (50-100 horas). Posee menor interferencia sobre el REM que los barbitúricos y la glutetímida. Es una de las benzodiazepinas que tiene mayor capacidad sedante; de ahí que se recomienda principalmente para tratar el insomnio, administrándose una dosis por la noche de 20 a 60 mg. Se ha utilizado con regular éxito en sonambulismo, terrores nocturnos y enuresis. No debe ser aplicado por un período mayor de seis semanas, porque sus efectos terapéuticos disminuyen notablemente, de la misma forma que todas las benzodiazepinas. Este medicamento tiene similitud con el clordiazepóxido en cuanto a sus efectos sedantes, relajantes musculares y anticonvulsivos.

Presentación

Frasco con 10 ó 30 cápsulas de 15 mg,

Frasco con 10 ó 30 cápsulas de 30 mg,

Dosis

20-60 mg/día (vía oral),

LORACEPAM (Ativan)

Las indicaciones y los efectos colaterales del loracepam son similares a los del diacepam. Se emplea principalmente para aliviar casos de insomnio. Cuando se han administrado dosis terapéuticas de este medicamento, se han descrito períodos de amnesia y ataxia. En trastornos psicossomáticos ha tenido también utilidad.

Presentación.

Caja con 30 tabletas de 1 mg.
Caja con 30 tabletas de 2 mg.

Dosis

Para ambulantes: 2-5 mg/día (vía oral).
Para internados: 5-10 mg/día (vía oral).

Comentarios

Las medidas generales utilizadas en la intoxicación por depresores del S.N.C. son también adecuadas para las benzodicepinas, a saber: efectuar lavado gástrico, administrar líquidos por vía intravenosa, y mantener en buen estado los signos vitales y las vías respiratorias. En estos casos, no se recomienda emplear estimulantes como benzoato de sodio o cafeína. La diálisis tiene un valor limitado. Con el simple mantenimiento del paciente en condiciones adecuadas, es suficiente para que éste se recupere. Generalmente, en la fase de recuperación se presenta un estado de agitación, el cual debe ser manejado con neurolépticos (haloperidol) y no con ansiolíticos u otros depresores.

NEUROLEPTICOS.

Generalidades e indicaciones.

El término neuroléptico lo ideó Delay (1954) para referirse a aquel medicamento capaz de producir lentitud psicomotriz, parkinsonismo, indiferencia emocional y mejoría de los síntomas psicóticos (la clorpromacina entre otros).

Los neurolépticos se administran intentando modificar síntomas ya que no son específicos para cada enfermedad, por ejemplo, un neuroléptico (haloperidol), se puede emplear para brote psicótico en un débil mental, para esquizofrenia, para un estado maniaco en una psicosis maniaco-depresiva o para una psicosis senil, debido a que estas entidades patológicas poseen síntomas susceptibles a tal neuroléptico. Este manejo sintomático ha llevado a los médicos a utilizar combinaciones de neurolépticos para atacar el complejo patológico que presenta determinado paciente; por ejemplo, emplean un neuroléptico sedante (levomepromacina) junto con un incisivo (haloperidol), para manejar al paciente con brote psicótico agudo y trastornos del sueño. Sin embargo, se ha demostrado que es mejor utilizar un ag

lo neuroléptico, ya que si se administra el haloperidol en una sola dosis diaria por la noche (10mg), se obtendrá un efecto hipnótico sin aumentar los efectos colaterales, evitándose la combinación medicamentosa. Esta combinación se recomienda sólo en contadas ocasiones y puede resultar nociva, ya que se ha demostrado que la polifarmacia aumentará los efectos colaterales indeseables, pero no los efectos antipsicóticos; además, la combinación puede dar resultados imprevistos y dificulta la valoración por parte del médico sobre el efecto terapéutico de cada neuroléptico.

Como guía general de tratamiento, cabe dar los siguientes ejemplos:

- 1) Una psicosis aguda con agitación psicomotriz se debe manejar con un neuroléptico potente (como el haloperidol) con dosis suficientes. Si se requiere administrar un neuroléptico por un tiempo prolongado, como en la esquizofrenia crónica, es importante utilizar un neuroléptico de acción prolongada, como el decanoato de flufenacina, el palmitato de pipotiacina o el penfluridol.
- 2) Un proceso esquizofrénico con escasos síntomas productivos debe ser manejado con un neuroléptico de baja o mediana potencia, como el tiotixeno o la trifluoperacina.
- 3) Un paciente esquizofrénico con escasos síntomas psicóticos, pero con efecto depresivo, adquiere mejoría si se le administra tioridacina o tioxixeno.

Otros casos importantes de los neurolépticos se dan en los siguientes casos: en las psicosis por L.S.D., por anfetaminas, por hongos alucinantes, por marihuana (en dosis bajas), en el autismo infantil, en el síndrome de Gilles de la Tourette, en las ideas delirantes con depresión endógena, como antimimético, en algún tipo de cefaleas tensionales y en insomnio. Una gran ventaja de los neurolépticos es que no producen dependencia y su toxicidad, en caso de intento de suicidio, es menor que la de otros fármacos.

Contraindicaciones.

Las contraindicaciones generales de todos los neurolépticos son las siguientes: hepatopatía, trastornos cardiovasculares, trastornos renales, trastornos metabólicos, lesión cerebral, intoxicación por algún depresor del S.N.C., embarazo, tendencia a la trombosis y síndrome de Parkinson.

Efectos colaterales.

Bajo la terapia con neurolépticos, los efectos colaterales que se presentan son los siguientes:

- 1) Disquinesia Paroxística, - También llamada distonía medicamentosa, se presenta después de 12 a 56 horas de haber administrado la primera dosis. Se caracteriza por movimientos de torsión del cuello hacia los lados o hacia atrás, acompañados de muecas, disartría, dificultad para respirar, protrusión de la lengua y otros movimientos involuntarios.
- 2) Parkinsonismo medicamentoso, - Este padecimiento presenta la misma sintomatología que la enfermedad de Parkinson, a saber: limitación de los movimientos generales, pérdida de la capacidad de los movimientos

asociados, rigidez, aumento del tono muscular, fenómeno de rueda dentada, temblor, amimia, marcha a pasos cortos, seborrea facial, hipersalivación y la figura tónica del parkinsonismo. Se presenta a partir de la primera semana del tratamiento prolongándose por dos o tres meses, generalmente.

- 3) Acatisia.- Este padecimiento es descrito por el paciente como una intranquilidad, nerviosismo, angustia y desesperación torturante.
- 4) Disquinesia Tardía.- Esta alteración es considerada por algunos autores como una lesión neuronal a nivel de los ganglios basales, producida por los neurolépticos. El trastorno consiste en movimientos orolingüofaciales que semejan la corea, y en ocasiones pueden presentarse movimientos de las extremidades superiores.
- 5) Crisis convulsivas.- Estas alteraciones se presentan con mayor frecuencia en personas con daño cerebral previo y cuando se administran grandes dosis inicialmente.
- 6) Ictericia.- Se presenta entre la segunda y tercera semana de tratamiento y se caracteriza por coloración dérmica y conjuntival amarilla, bilis en la orina y altos niveles de fosfatasa alcalina. Esta reacción ha sido considerada como una hipersensibilidad al medicamento.
- 7) Leucopenia o leucocitosis.- Estas alteraciones, que suceden principalmente son tricíclicos, se pueden presentar entre la segunda y cuarta semana del tratamiento.
- 8) Agranulocitosis.- Este es un trastorno que ocurre muy rara vez, en ocasiones se presenta hasta la décima semana del tratamiento.

Clasificación de los neurolépticos.

CLORPROMACINA (Largactil)

La clorpromacina fue el primer neuroléptico que se utilizó; existe mucha bibliografía sobre sus efectos. Actualmente, debido al descubrimiento de otros neurolépticos, se usa cada vez menos, por sus marcados efectos colaterales. Es necesario controlar frecuentemente la fórmula leucocitaria (cada quince o treinta días), porque hay peligro de granulocitosis. Debe preverse la posibilidad de que se presente ictericia, fotosensibilidad, hipotensión arterial y estados confusionales. Los efectos extrapiramidales se controlan fácilmente con un anticolinérgico.

Se recomienda administrar clorpromacina a pacientes que sufren de brotes psicóticos agudos, con agitación psicomotriz, así como en casos crónicos.

Presentación,

- Caja con 50 ó 20 comprimidos de 25 mg.
- Caja con 50 ó 20 comprimidos de 100 mg.
- 40 mg = frasco con 10 ml al 4 %.
- Caja con 5 supositorios de 25 mg.
- Caja con 5 supositorios de 10 mg.
- 25 mg = 5 ml (vía intramuscular) caja con 10 ampollitas.
- 50 mg = 2 ml (vía intravenosa) caja con 5 ampollitas

Dosis

Ambulantes: 75-200 mg/día (vía oral).

Internados: 150-600 mg/día (vía oral).

I.M. ó I.V.: 25-50 mg no administrar más de 200 mg al día.

TIORIDACINA (Melleril)

En México no existe la presentación parenteral. La tioridacina es más eficaz en casos de psicosis esquizofrénica con escasos síntomas alucinatorios y delirantes, resulta particularmente útil en pacientes con depresión y negativismo. No debe usarse como antidepresivo en casos de depresión, porque puede agravar el cuadro. Tampoco es recomendable en psicosis aguda con agitación psicomotora. En trastornos emocionales de la infancia ha demostrado alguna utilidad. También se recomienda administrarla a pacientes con trastornos psicósomáticos y disforias del epiléptico (conjuntamente con la medicación anticonvulsiva).

Debido al bajo grado de somnolencia y de efectos extrapiramidales de la tioridacina, los pacientes que reciben este medicamento pueden desempeñar ciertas labores y facilitar su proceso de reintegración social (ergoterapia, terapia ocupacional, etc.). En dosis altas, el control del electrocardiograma es indispensable. Se han visto trastornos de la erección de inicio y mantenimiento con dosis tan bajas como 50 mg al día.

En pacientes a quienes se administra este medicamento, puede haber eyaculación retrógrada dolorosa: el semen se aloja en la vejiga y después se elimina por la orina (no confundir con una infección en las vías urinarias), lo cual puede causar severa angustia al paciente. En mujeres, la tioridacina puede tener buen efecto contra la hiperexcitación sexual.

Presentación.

Envase con 30 grageas de 10 mg.

Envase con 24 ó 100 grageas de 25 mg.

Envase con 24 ó 100 grageas de 100 mg.

10 mg = 1 cucharada, frasco en suspensión de 150 ml.

Envase con 20 comprimidos de 200 mg.

Dosis

Ambulantes: 100-200 mg/día (vía oral)

Internados: 900 mg máximo/día (vía oral)

Comentarios

Es importante que el médico que utilice un neuroléptico tenga conciencia de que se trata de un medicamento que puede producir efectos colaterales severos, por tanto, el neuroléptico no debe ser administrado sólo como calmante o para trastornos, los cuales son poco claros y "parecen ser psicógenos",

Ante todo, se debe estar seguro de que los síntomas que el paciente presenta son susceptibles al tratamiento con un neuroléptico.

Si un paciente no reacciona en forma favorable después de tres meses de administración de un neuroléptico a dosis suficientes, se considera que es resistente a tal medicamento. Antes de cambiar a otro neuroléptico, hay que ver si el paciente efectivamente toma el medicamento o si existen trastornos en la absorción.

HIPNOTICOS

Generalidades

Existen numerosos fármacos que poseen la propiedad de inducir el sueño, en éstos párrafos se describirán sólo aquellos cuya utilidad primordial es la hipnótica.

Para definir un hipnótico, se debe tener en cuenta la dosis; si se administra cierta cantidad de un medicamento se obtendrá un efecto hipnótico; cuando la dosis es menor, se puede obtener sedación o tranquilización; y cuando la dosis es mayor, el medicamento tendrá efectos narcóticos.

Antes de administrar un hipnótico, se deben conocer bien los hábitos de sueño y vigilia del insomne, teniendo en cuenta su trabajo, siesta, ingestión de estimulantes (café, té, etc.), ejercicio físico, ambiente social y personalidad.

Indicaciones

Se ha considerado que existen tres tipos de insomnio:

- 1) Orgánico.- Debido a lesión cerebral de cualquier tipo (arteriosclerosis, etc.). Para este trastorno, el hidrato de cloral es el medicamento de elección, También puede utilizarse un neuroléptico con propiedades sedantes. Por otro lado, se ha recomendado para este trastorno, al igual que para el insomnio en ancianos, administrar un estimulante durante el día a fin de mejorar el estado de alerta en la vigilia, con lo cual por la noche se obtendrá el ritmo de sueño normal. Las alteraciones del sueño por insuficiencia cardíaca deben ser tratadas desde el punto de vista de la medicina interna.
- 2) Psicótico.- En casos de manía o esquizofrenia se recomienda usar un neuroléptico, mientras que en insomnio por depresión debe aplicarse un antidepresivo con características sedantes. En algunas ocasiones se tiene que añadir a la medicación antipsicótica un benzodiazepínico en forma temporal.
- 3) Psicógeno.- En estos casos, los medicamentos se deben usar después de examinar bien al paciente y luego de llevar a cabo una psicoterapia. Si estas medidas fallan, se debe utilizar un hipnótico.

Contraindicaciones.

Porfiria, hepatopatía, nefropatía y tendencia a la farmacodependencia. Se

puede presentar potencialización cuando los barbitúricos se administran -- con otros depresores del S.N.C. Si se combinan con alcohol, pueden tener efectos letales.

Efectos secundarios.

La somnolencia, efecto terapéutico que se busca, se presenta no sólo por la noche, sino que generalmente se prolonga durante el día, produciendo en el paciente falta de concentración, dificultad para realizar tareas motoras que implican precisión, etc. Estas modificaciones pueden producir en el individuo una alteración en el estado de ánimo, presentándose irritabilidad, cansancio, apatía, etc. Estos efectos colaterales no se pueden explicar por los niveles sanguíneos del hipnótico, sino que son resultado de la alteración de algunos fenómenos que ocurren en forma natural durante el sueño y que bajo la terapia hipnótica se modifican. Los hipnóticos con excepción del hidrato de cloral, disminuyen el REM.

Clasificación de los hipnóticos.

BARBITURICOS.

FENOBARBITAL (Sedilín, acción prolongada).

Los barbitúricos producen todos los grados de depresión del S.N.C. desde sedación hasta coma. A dosis hipnóticas terapéuticas se pueden presentar trastornos en el aprendizaje, en el juicio, en la memoria a corto plazo y en la capacidad para realizar tareas que requieren alguna habilidad. El resto de los hipnóticos también tienen estos efectos colaterales. Los barbitúricos no tienen efecto analgésico; incluso en bajas dosis pueden producir hiperalgesia y antagonizar otros analgésicos. En casos de intoxicación, además en las medidas generales, la diálisis es de gran utilidad.

Presentación.

Frasco con 30 comprimidos de 10 mg.

Dosis

Adultos: 60-150 mg/día (vía oral).

Niños: 20-40 mg/día (vía oral).

Comentarios

Los barbitúricos disminuyen la eficacia de la mayoría de los psicotrópicos, porque inducen el aumento del metabolismo de éstos fármacos. Se ha visto que en pacientes geriátricos se puede presentar una reacción paradójica al administrar un hipnótico exacerbando el insomnio y presentando reacciones

de agitación psicomotora.

Todos los hipnóticos pueden producir tolerancia y dependencia; por ello, es prudente retirarlos lo más pronto posible. Si se utilizan por tiempo prolongado, pueden ocasionar desinterés, lentitud psicomotriz, trastornos afectivos, ansiedad e inquietud, lo cual suele agravar el cuadro clínico del insomnio. Con mucha frecuencia los pacientes que tienen insomnio presentan también depresión, por ello, se debe tener en cuenta el riesgo de suicidio y la posibilidad de que se utilicen los hipnóticos con este propósito. Es de gran utilidad explicar al paciente que el alcohol puede potenciar los efectos colaterales de estos medicamentos y desarrollar cuadro tóxico.

BIBLIOGRAFIA

- 1) DRILL, VICTOR A.
FARMACOLOGIA MEDICA
PRIMERA EDICION, 1974
EDITORIAL. PRENSA MEDICA MEXICANA
- 2) GOODMAN, LOUIS S.
GILMAN, ALFRED
BASES FARMACOLOGICAS DE LA TERAPEUTICA
QUINTA EDICION, 1979
EDITORIAL. INTERAMERICANA
- 3) GOTH, ANDRES
FARMACOLOGIA MEDICA
OCTAVA EDICION, 1979
EDITORIAL. INTERAMERICANA
- 4) MEYERS, FREDERIK H.
MANUAL DE FARMACOLOGIA CLINICA
TERCERA EDICION 1977
EDITORIAL. EL MANUAL MODERNO
- 5) SECRETARIA DE SALUBRIDAD Y ASISTENCIA
CUADRO BASICO DE MEDICAMENTOS DEL SECTOR
PUBLICO
MEXICO, 1979
- 6) URIARTE, VICTOR
PSICOFARMACOLOGIA
PRIMERA EDICION, 1978
EDITORIAL TRILLAS

UNIDAD VII

ANTIINFLAMATORIOS

Generalidades

Suele haber una superposición de los efectos antiinflamatorios e inmunosupresores de diversos medicamentos. Por ejemplo, los corticoesteroides poseen ambas acciones.

La forma más sencilla de explicar la superposición es considerar que la lesión inmune origina una inflamación a consecuencia de la actividad de las células inflamatorias. Los medicamentos que disminuyen el número de estas células o inhiben sus actividades pueden ejercer ambas acciones, antiinflamatoria e inmunosupresora.

Las drogas citotóxicas inhiben la multiplicación de las células, mientras que los medicamentos antiinflamatorios ligeros pueden ejercer efectos más sutiles sobre las células inflamatorias, o pueden bloquear las acciones de sus productos. Teóricamente los medicamentos antiinflamatorios pueden bloquear los efectos de factores leucotácticos sobre células inflamatorias, o pueden inhibir la elaboración de mediadores por dichas células. Pueden asimismo bloquear la acción de los mediadores. Ninguna teoría sencilla, como la de la estabilización de los lisosomas, basta para explicar todas las diferencias en el espectro de actividad de los diversos tipos de medicamentos antiinflamatorios.

En contraste con los analgésicos narcóticos, un grupo de medicamentos analgésicos muy utilizados, de los cuales son ejemplo los salicilatos, tienen propiedades antipiréticas, y la mayor parte también son antiinflamatorios. Estas drogas analgésicas-antipiréticas pertenecen a cuatro clases químicas: salicílicos, pirazonas, derivados del para-aminofenol, y el grupo más nuevo de indometacina, ácido mefenámico e ibuprofeno.

Los salicilatos, pirazonas, oxifenbutazona derivado de fenilbutazona, ya fueron descritos en el capítulo correspondiente a analgésicos, por lo cual ya no se mencionaran.

INDOMETACINA

Generalidades

La indometacina fue producto de la busca en el laboratorio de fármacos con propiedades antiinflamatorias. Se introdujo en 1963 para tratar la artritis reumatoide y trastornos afines. Aunque es agente eficaz, la toxicidad sugiere limitar su empleo.

Aunque la indometacina es más potente que la aspirina, los efectos antiinflamatorios de las dosis toleradas de indometacina en la artritis reumatoide no son mejores que los salicilatos.

Indicaciones

Ha sido útil como antipirético en enfermedad de Hodgkin si la fiebre no ha cedido con otro medicamento.

Se utilizan en el tratamiento de la artritis reumatoide. La indometacina alivia el dolor, disminuye la tumefacción y el adolorimiento de las articulaciones y aumenta la fuerza de prensión. Es útil en espondilitis anquilosante, osteoartritis y artritis psoriásica. Los ataques agudos de gota también mejoran con la indometacina, pero suele preferirse colchicina o fenilbutazona.

Contraindicaciones

No se recomienda usar la indometacina como analgésico general o antipirético, por la elevada frecuencia e intensidad de los efectos secundarios que ocasiona su administración crónica.

No debe darse a mujeres embarazadas, ni a los niños, ni a personas que trabajan con máquinas, ni a pacientes con trastornos psiquiátricos, epilepsia o parkinsonismo. Está contraindicada en individuos con enfermedad renal o lesiones ulceradas de estómago o intestino.

Efectos secundarios

Alrededor de 35 a 50 por 100 de los pacientes que reciben dosis terapéuticas corrientes de indometacina experimentan síntomas perjudiciales, y aproximadamente 20 por 100 deben suspender el fármaco.

La mayor parte de los efectos secundarios guardan relación con la dosis. Los trastornos y complicaciones gastrointestinales son anorexia, náusea, dolor abdominal y úlcera péptica, a veces con hemorragia y perforación. Se han registrado casos de pancreatitis aguda. Puede producir diarrea, a veces con lesiones ulcerosas de intestino. Las lesiones hepáticas son raras. En el S.N.C. el efecto más frecuente es la fuerte cefalalgia frontal, que sienten 25 a 50 por 100 de los individuos que toman el fármaco por mucho tiempo. Son frecuentes los vahídos, el vértigo, atolondramiento y confusión mental. Se han registrado grave depresión psicosis, alucinaciones y suicidios. Los pacientes alérgicos a la aspirina pueden presentar reacción cruzada con la indometacina.

Dosis y vías de administración

La indometacina, se expende para uso bucal; las cápsulas oficiales poseen 25 ó 50 mg del fármaco, su nombre comercial Indocin. La dosis inicial es de 25 mg dos veces al día, que puede aumentarse por incremento semanal de 25 mg hasta la dosis diaria total de 100 a 150 mg; pocos pacientes toleran más de 100 mg sin efectos secundarios graves. El fármaco debe repetirse en tomas que se ingieren con alimentos o inmediatamente después de comer, para disminuir las molestias gástricas. Se afirma que una dosis de indometacina ingerida con la leche al acostarse disminuye la frecuencia de cefalalgias matutinas.

Hay supositorios de indometacina pero el efecto terapéutico no ha sido constante. Se han eliminado las tabletas comprimidas, pues se endurecen con el almacenamiento y se absorben de modo que no puede predecirse,

Comentarios

En odontología no debe utilizarse Indometacina, debido a su gran toxicidad y efectos secundarios que causa, además de que contamos con fármacos antiinflamatorios menos tóxicos, que pueden administrarse sin tanto riesgo para el paciente y con acción antiinflamatoria.

ACIDO MEFENAMICO Y AGENTES AFINES (Ponstan)

Es un derivado del ácido antranílico, en dosis de 250 a 500 mg brinda analgesia semejante a la producida por la aspirina, y muy poca acción antiinflamatoria, sin embargo debe limitarse su uso debido a su gran toxicidad. Si se utiliza debe emplearse menos de 7 días, en caso de ocurrir diarrea el medicamento habrá de suspenderse y no se reanudará. No debe emplearse en niños ni en mujeres en edad fecunda.

En odontología no debe utilizarse por el riesgo y toxicidad que provoca en el paciente.

IBUPROFENO (Motrin)

Es un derivado del ácido fenilpropiónico, su efecto antiinflamatorio en la artritis reumatoide es menor que el de dosis completas de aspirinas. En dosis bajas, el ibuprofeno es más analgésico que antiinflamatorio. En algunos pacientes hay cefalalgia y otros efectos centrales, y se han advertido modificaciones en las pruebas de función hepática. Han ocurrido agudeza visual y defectos de los cambios visuales. La dosis para tratamiento sintomático de la artritis reumatoide es de 900 a 1 600 mg al día. El fármaco es costoso.

En odontología no tiene uso debido a su bajo poder antiinflamatorio y a su gran toxicidad en cuanto a su poder analgésico, se cuenta con otros medicamentos para lograr la analgesia, además de que es costoso.

ENZIMAS

Las enzimas que a continuación daremos, se describen en este capítulo debido a que el odontólogo las utiliza en tratamientos para traumatismos, hematomas, y para acelerar la formación del coágulo.

PROTEOLITICAS

Se conocen algunas enzimas proteolíticas que poseen la propiedad de acelerar la formación del coágulo. Ejemplo de ellas son la tripsina y ciertos venenos de culebras que contienen enzimas proteolíticas de los cuales el veneno de víbora Russell es el más potente; mínimas cantidades de este agente promueven la formación de coágulos, acelerando la actividad de la protombina a trombina aun en ausencia de tromboplastina, aunque la presencia de tromboplastina aumenta considerablemente su efectividad.

Aunque la tripsina posee, in vitro, el efecto acelerador de la coagulación descrito antes, es usada clínicamente por su acción proteolítica clásica. La fibrina de los coágulos sanguíneos es rápidamente licuada por acción de la tripsina y el tejido fibroso no es influido por la enzima. La aplicación local de tripsina constituye un método de desbridamiento enzimático de la superficie de las heridas. La inyección de tripsina en las cavidades del cuerpo puede exponer áreas necrosadas y causar hemorragias o la formación de trayectos fistulosos. La enzima también degrada la hemoglobina, pero la sangre fresca contiene inhibidores específicos e inespecíficos de la tripsina que son de rápida acción; por lo tanto, la enzima no es efectiva en presencia de sangre fresca. La aplicación o inyección de tripsina puede provocar una reacción de tipo histamínico, que es rápidamente controlada con el uso de agentes antihistamínicos.

La tripsina es obtenida del tejido pancreático de animales usados para la alimentación humana. Las preparaciones obtenibles son valoradas en base a su acción proteolítica sobre la hemoglobina, de manera que 1000 unidades representan una actividad igual a la de un miligramo de la tripsina patrón Hofilizada y cristalina. Se disuelve en solución tampón adecuada de fosfato, se hacen soluciones que contengan 200 a 500 mg de tripsina por aplicación y deben cambiarse cada 2 a 3 horas hasta que se haya alcanzado el desbridamiento deseado.

FIBRINOLISINA

La fibrinolisisina activa de sangre humana se obtiene como actasa y trombolisisina. La preparación es hecha dejando que la estreptoquinasa active a la profibrinolisisina obtenida de plasma sanguíneo humano. Es normalizada en base a las unidades de actividad fibrinolítica determinada in vitro. Se le ha usado por inyección intravenosa en un intento de promover la disolución de coágulos sanguíneos, pero la efectividad de la acción lítica en seres humanos aún no ha sido establecida. Su uso se acompaña de varios efectos indeseables:

- 1) Degradación del fibrinógeno que se demuestra por disminución de los -

niveles de fibrinógeno del plasma en los seres humanos que hayan recibido fibrinolisis:

- 2) Respuesta febril, que es posiblemente el resultado de impurezas en la preparación, tales como estreptoquinasa;
- 3) Efectos antigénicos de la preparación, la cual después de su administración repetida puede producir intensas reacciones alérgicas.

ESTREPTOCINASA Y ESTREPTODORNASA

La estreptocinasa y la estreptodornasa son enzimas que se producen durante la proliferación de algunas cepas de estreptococo hemolítico. La estreptocinasa es activadora del plasminógeno y disuelve coágulos sanguíneos y la porción fibrinosa de exudados. La estreptodornasa hidroliza la desoxirribonucleoproteína y, por ello licua la nucleoproteína viscosa de células muertas; carece de efecto sobre células vivientes. Estas enzimas suelen utilizarse simultáneamente para ayudar a eliminar coágulos sanguíneos y acumulaciones fibrinosas o purulentas después de traumatismos o inflamación.

Usos y dosis

La estreptocinasa-estreptodornasa se emplea para eliminar sangre coagulada y exudado fibrinoso o purulento que se producen por traumatismos, se usa como auxiliar en el tratamiento de hemotórax, hematoma y empiema y en el tratamiento de las supuraciones crónicas, como senos infectados, otomielitis, heridas o úlceras infectadas. Tal tratamiento puede considerarse sólo como complemento de la desbridación quirúrgica y drenaje del tratamiento con antibióticos. La estreptocinasa-estreptodornasa (Varidasa) se expande como jalea (100 000 unidades de estreptocinasa y 25 000 unidades de estreptodornasa en 15 ml), en polvo para solución inyectable (20 000 unidades de estreptocinasa y 5 000 unidades de estreptodornasa en un frasquito), en polvo para aplicación tópica (100 000 unidades de estreptocinasa y 25 000 unidades de estreptodornasa en un frasquito) y en tabletas bucales (10 000 unidades de estreptocinasa y 2 500 unidades de estreptodornasa), nunca debe administrarse por vía intravenosa.

La mezcla de estreptocinasa y estreptodornasa se administra por inyección en cavidades y se aplica localmente en forma de apósitos húmedos. Es esencial que la mezcla quede en íntimo contacto con el substrato. En las áreas cerradas deben tomarse las medidas de precaución para eliminar el aumento de líquido que se origina por la acción licuante de las enzimas. Para el hemotórax y el empiema torácico, la dosis inicial es de 200 000 unidades de estreptocinasa y 50 000 unidades de estreptodornasa en no menos de 10 ml de solución isotónica de cloruro sódico. Una dosis inicial suficiente en el empiema del seno maxilar es de 10 000 a 15 000 unidades de estreptocinasa y de 2 500 a 3 750 unidades de estreptodornasa en 2 ó 3 ml de solución. Pueden aplicarse concentraciones semejantes en apósitos húmedos cuando está indicada la desbridación enzimática.

Comentarios

Considerando que todos los antiinflamatorios tienen efectos colaterales se debe definir muy bien el factor local o general que este causando la inflamación para así poder contrarrestarla y elegir el antiinflamatorio menos tóxico.

Ya que se sabe que la inflamación es una respuesta inmune del organismo, habrá ocasiones en las que no sea necesario administrar antiinflamatorio, sino atacar el factor que este provocando la inflamación.

BIBLIOGRAFIA

- 1) ANTI-INFLAMATORY AGENTS
ANTIPYRETIC EFFECT OF ACETAMINOPHEN SUPPOSITORIES IN RATS
LOCK A. ET. AL. J. PHARM SCI 1979, SEP 68 (9) 1105-7
- 2) DRILL, VICTOR A.
FARMACOLOGIA MEDICA
PRIMERA EDICION, 1974
EDITORIAL PRENSA MEDICA MEXICANA
- 3) GOODMAN, LOUIS S.
GILMAN, ALFRED
BASES FARMACOLOGICAS DE LA TERAPEUTICA
QUINTA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 4) GOTH, ANDRES
FARMACOLOGIA MEDICA
OCTAVA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 5) MEYES, FREDERIK H.
MANUAL DE FARMACOLOGIA CLINICA
TERCERA EDICION 1977
EDITORIAL EL MANUAL MODERNO
- 6) SECRETARIA DE SALUBRIDAD Y ASISTENCIA
CUADRO BASICO DE MEDICAMENTOS
DEL SECTOR PUBLICO.
MEXICO 1979.

RESULTADOS Y DISCUSION

La Odontología, con suma rapidez, está alcanzando un papel propenderante en la profesión médica debido, en gran parte, a las mayores y crecientes responsabilidades en la atención al paciente.

Aunque el odontólogo todavía depende de su habilidad técnica, la importancia concedida a la orientación biológica en la práctica dental nos marca la necesidad de que el odontólogo tenga conocimientos de farmacología clínica.

La ampliación de los parámetros de prevención de la enfermedad bucal, así como la conservación de la boca en buen estado, han hecho que no sea suficiente ni aceptable que el odontólogo tenga como única tarea la reparación de las lesiones dentales. Necesita fundamentos y conocimientos científicos suficientemente sólidos que le permitan examinar al paciente, valorar los diversos hallazgos bucales y parabucles, extraer una conclusión diagnóstica y emprender el tratamiento adecuado; localizar el factor local o general que este causando el daño y dar su tratamiento o en su defecto transferir al paciente con el médico o especialista que necesite.

Hay muchos factores que deben originar un cambio en los programas de enseñanza de Odontología. Los cuales tengan como finalidad la información más reciente de las ciencias básicas y las responsabilidades de la Odontología clínica.

En los capítulos que se describieron en páginas anteriores, se trato de dar un enfoque a la farmacología clínica aplicada a los padecimientos más comunes en odontología haciendose un elección cuantitativa y cualitativa de los fármacos.

CONCLUSIONES

Después de haber analizado las encuestas que se hicieron a pacientes y Cirujanos Dentistas titulados y estudiantes, podemos decir que el nivel académico de farmacología clínica es muy bajo en general, de acuerdo a los altos porcentajes que se obtuvieron en estas encuestas de la mala elección de fármacos y el uso indiscriminado de ellos, confirmando así nuestra hipótesis.

PLANTEAMIENTO SUPERADOR

- 1) Integrar en un Modulo del plan de estudios, el manejo clínico de la farmacología.
- 2) Crear cursos de actualización de farmacología clínica.
- 3) Realizar evaluaciones antes de la administración de cualquier tipo de farmaco para los estudiantes y una autoevaluación del profesionalista.
- 4) No dejarse guiar por la publicidad comercial , sino verificar el farmaco antes de recetarlo.
- 5) Elaborar manuales o cuadros básicos prácticos con carácter clínico y no tan comercial. (Anexamos cuadro básico de medicamentos efectivos, con baja toxicidad y bajo costo).

CUADRO BASICO DE FARMACOS

A continuación se describen los fármacos mas usados y que recomendamos, para uso de la Odontología clínica, para cada uno de los padecimientos con los que el Cirujano Dentista se enfrenta en su práctica profesional. Se ha hecho la elección de acuerdo a la efectividad de los medicamentos, así como al bajo costo que tienen en el mercado.

ANESTESICOS MAS EMPLEADOS

1) Nombre comercial:	XILOCAINA
Base:	Lidocaína
Grupo:	Amida

ACCION E INDICACIONES: Reúne propiedades que no tienen otros anestésicos: Su período de latencia es muy breve. La extensión y profundidad es de 2-3 veces mayor que la que producen los anestésicos procaínicos. Variando su concentración, volumen y contenido de vasoconstrictor se puede controlar la duración, dentro de límites muy amplios. Aplicada sobre mucosas, heridas, también constituye un excelente anestésico tópico. A diferencia de los derivados del ácido p-aminobenzoico, carece de efectos alérgicos.

En odontología se usa en anestesia dental, cirugía bucal y anestésica tópica bucal.

CONTRAINDICACIONES: Hasta la fecha no se conocen contraindicaciones para la Xylocaína debiendo valorarse su uso en aquellas personas que se sabe son hipersensibles a los anestésicos locales.

REACCIONES SECUNDARIAS: Con sobredosificación o en personas hipersensibles pueden presentarse, mareos, escalofríos, nerviosidad y náuseas.

PRESENTACION: Solución inyectable al 1 y 2% con epinefrina. Frascos ampulla de 50 ml. Cartuchos dentales al 2%, con epinefrina 1:100,000 caja de plástico con 50 cartuchos de 1,8 ml. Spray al 10% (con sabor) y sin sabor, frasco aerosol de 80 g. Unguento al 5%. Tubos de 15 y 35 g. Tarro de 45 g.

2) Nombre comercial:	CITANEST
Base:	Prilocaína
Grupo:	Amida

ACCION E INDICACIONES: Tiene el mismo corto período de latencia, la excelente profundidad, la buena difusión y la misma incidencia de anestesia satisfactoria que la de lidocaína; acción más prolongada y toxicidad 50% menos que Xylocaína. Ofrece así mayor seguridad y mayor eficacia y se considera hasta ahora el anestésico local de elección en bloqueos y en

anestesia regional endovenosa.

CONTRAINDICACIONES: En anestesia regional y por infiltración: Sepsis - de la región en donde se va a inyectar, choque severo y bloqueo cardíaco. Las contraindicaciones relativas son: enfermedad neurológica presente, de formidades de la columna vertebral, septicemia, hipertensión e hipotensión severas y juventud extrema, y en personas hipersensibles a la prilocaína.

REACCIONES SECUNDARIAS: En personas hipersensibles pueden presentarse náusea, cefalea, vómito, taquicardia.

PRESENTACION: Solución inyectable al 2% con epinefrina al 1:200,000 frasco de 50 ml. Solución inyectable al 2% sin epinefrina, frasco ampula de 50 ml. Citanest Octapresin cartuchos dentales, caja de plástico con 50 cartuchos de 1.8 ml.

3) Nombre comercial:	CARBOCAINA
Base:	Mepivacaína
Grupo:	Amida

ACCION E INDICACIONES: Estabiliza la membrana neuronal, e impide la iniciación y transmisión de los impulsos nerviosos, produciendo en esta forma la anestesia local. La acción se inicia rápidamente. Generalmente no produce irritación ni alteración tisular. Está indicada en los procedimientos dentales de anestesia local por infiltración o bloqueo troncular.

CONTRAINDICACIONES: Está contraindicado en enfermos de conocida hipersensibilidad a los anestésicos locales del tipo de las amidas.

Uso en el embarazo: No se ha establecido la inocuidad en el uso de Carbocaina en cuanto a posibles efectos adversos sobre el desarrollo del feto. Esto deberá tenerse en cuenta antes de administrar el anestésico durante el embarazo.

REACCIONES SECUNDARIAS: Las reacciones adversas generales que afectan al sistema nervioso central y el cardiovascular resultan usualmente de niveles plasmáticos elevados debidos a dosis excesivas, absorción rápida, o inyección intravascular accidental.

Las reacciones que afectan el sistema nervioso central se caracterizan por excitación o depresión, o ambas. Pueden presentarse nerviosidad, mareos, visión borrosa o temblores, seguidos de somnolencia, convulsiones, pérdida del conocimiento y posiblemente parálisis respiratoria.

Las reacciones alérgicas se caracterizan por lesiones cutáneas tardía o urticaria, edema y otras manifestaciones alérgicas. Las pruebas de sensibilidad de la piel son de valor dudoso.

PRESENTACION: Carbocain al 2% con Neo-nordefrina al 1:20,000 Carbocain cartuchos de 1,8 ml, envasados en latas de 50.

ANTIBIOTICOS MAS EMPLEADOS

A base de penicilinas naturales (Espectro reducido)

1) Nombre comercial:	PENPROCILINA		
Formula:	Penicilina G sódica cristalizada	100,000 200,000	500,000 U.
	Penicilina G procaí- nica	300,000 600,000	1,500,000 U.
	Diluyente	2 ml 2 ml	5 ml

INDICACIONES: Infecciones causadas por organismos susceptibles a la penicilina.

CONTRAINDICACIONES: Personas hipersensibles a la penicilina.

REACCIONES SECUNDARIAS: Al igual que con todas las penicilinas, pueden presentarse reacciones alérgicas.

DOSIS: Variable por la intensidad del padecimiento y a juicio del médico.

PRESENTACION: Caja con un frasco ampula y diluyente.

2) Nombre comercial:	BENZETACIL		
Formula:	Dibenziletildiamina dipenicilina G	600,000 1,200,000	2,400,000 U.
	Citrato de sodio	0.006 0.012	0,024 g.

INDICACIONES: Tratamiento de infecciones debidas a microorganismos sensibles a la penicilina G que son susceptibles a los niveles séricos bajos y prolongados.

CONTRAINDICACIONES: Historia previa de reacción de hipersensibilidad a cualquiera de las penicilinas, debe considerarse como una contraindicación.

REACCIONES SECUNDARIAS: Las reacciones de hipersensibilidad que han sido reportadas son: Erupciones cutáneas (dermatitis maculopapular hasta dermatitis exfoliativa), urticarias y otras reacciones de enfermedades del suero, edema laríngeo y anafilaxis. Puede presentarse fiebre y eosinofilia,

DOSIS: Para profilaxis de fiebre reumática en adultos y niños mayores de 6 años: 1'200,000 U. cada 4 semanas y en niños menores de 6 años: 600 000 U. cada 4 semanas.

Para infecciones estreptocócicas: Amigdalitis, faringitis, escarlatina, impétigo, erisipela en adultos y niños mayores de 6 años: 1'200,000 U. y en niños menores de 6 años 600,000 U.

En heridas recientes para prevenir el tétanos en adultos y niños mayores de 6 años: 1'200,000 U. y en niños menores de 6 años es la misma dosis, - aplicando 2 ó 3 días después una inyección de toxoide tetánico.

3) Nombre comercial: BENZETACIL COMBINADO

Formula: Dibenziletildiamina dipenicilina G	600,000 U.
Penicilina G procaínica	300,000 U.
Penicilina G potásica	300,000 U.
Citrato de sodio (amortiguador)	0.009 g.
La ampolleta con diluyente contiene: de agua inyectable esterilizada.	1.5 ml.

INDICACIONES: Amigdalitis, faringitis, otitis media aguda, escarlatina, - celulitis, erisipela, mastoiditis y neumococias en estas enfermedades se - debe aplicar una cada 12 ó 24 horas, 2 ó 3 aplicaciones son suficientes. Prevención y tratamiento de infecciones quirúrgicas y traumáticas, una apli cación que a criterio médico podrá repetirse a las 48 horas. En heridas recientes para evitar el tétanos, dos aplicaciones con intervalos de 12 ó 24 horas, aplicando después, al 3o. ó 4o. días.

CONTRAINDICACIONES: Una reacción previa de hipersensibilidad a cualquier penicilina o procaína es una contraindicación.

REACCIONES SECUNDARIAS: La penicilina es una sustancia de baja toxicidad, pero tiene un índice significativo de sensibilización. Han sido repor tadas las siguientes reacciones de hipersensibilidad asociadas con el uso de penicilina: Rashs cutáneos que van desde erupciones maculopapulares hasta dermatitis exfoliativa, urticaria, reacciones parecidas a la enferme-- dad del suero, incluyendo escalofrío, fiebre, edema, artralgia y postración. Se han reportado también casos severos, y en ocasiones fatales de anafila_ xia.

DOSIS: Ya se dió en las indicaciones.

4) Nombre comercial: PEN-VI-K

Formula: Es penicilina V potásica oral con eficacia y actividad similar a la inyectable. Cada tableta contiene 250 mg que equivalen a 400 000 U. de penicilina. Cada cucharadita (5 ml) de la suspensión contiene 125mg que equivalen a 200,000 U de penicilina.

INDICACIONES: Infecciones estreptocócicas; Amigdalitis, faringitis, escarlatina, erisipela, se administra 250 mg cada 6 u 8 horas durante 10 días. Infecciones neumocócicas del tracto respiratorio, incluyendo otitis media aguda, 250 mg cada 6 horas, hasta que el paciente esté afebril por lo me- nos 2 días. Abscesos gingivales, fusosproquetosis de la orotaringe, - 250 mg cada 6 horas. Prevención de la fiebre reumática, 250 mg 2 veces

al día en forma continuada.

CONTRAINDICACIONES: Previa reacción de hipersensibilidad a cualquier penicilina.

REACCIONES SECUNDARIAS: Aunque la incidencia de reacciones a las penicilinas orales se ha reportado con mucho menor frecuencia que con penicilinas parenterales, debe recordarse que todos los grados de hipersensibilidad incluyendo anafilaxia fatal, se han presentado con penicilina oral. Las reacciones más comunes son: Náusea, vómito, distensión epigástrica, diarrea y lengua negra. Las reacciones de hipersensibilidad reportadas son: Erupciones cutáneas, desde erupciones maculopapulares hasta dermatitis exfoliativa; urticaria, edema laríngeo y anafilaxis.

Si se presentan reacciones alérgicas, suspender la droga y emplear los agentes usuales: Antihistamínicos, corticoesteroides y aminas presoras.

PRESENTACION: Tabletas: Caja con 20 de 250 mg de penicilina V potásica. Polvo para solución oral: Frasco de 90 ml.

ANTIBIOTICOS A BASE DE ERITROMICINAS (Espectro medio)

1) Nombre comercial:	PANTOMICINA
Formula:	Estearato de eritromicina

INDICACIONES: Su acción es bactericida dependiendo de la dosis, contra gérmenes grampositivos (como el estreptococo, el estafilococo y el neumococo) y algunos gramnegativos (como el Haemophylus influenzae) Es eficaz en las infecciones del tracto respiratorio, tales como: amigdalitis, faringitis, laringitis, sinusitis, otitis, traqueítis, bronquitis neumonía y bronconeumonía.

Se absorbe rápidamente, no destruye la flora intestinal normal, no produce daño hepático o renal en alteraciones hemáticas y la resistencia bacteriana transferible,

CONTRAINDICACIONES: Pacientes con hipersensibilidad a la eritromicina, No debe administrarse por vía intravenosa o subcutánea, Administrar con precaución en pacientes con insuficiencia hepática,

REACCIONES SECUNDARIAS: Ocasionalmente se puede presentar molestias gastrointestinales con las formas orales y estan relacionadas con la dosis, Pueden producirse leves reacciones del tipo de urticaria, Se han reportado reacciones alérgicas serias, incluyendo anafilaxia,

PRESENTACION Y DOSIS

Pantomicina 500, tabletas 500 mg, adultos 1 tableta 3 veces al día,

Pantomicina, tabletas 250 mg, adultos 1 tableta c/6 horas o 2 c/8 horas.
 Pantomicina granulos, suspensión oral 125 mg/5ml, niños 30-50 mg/kg por día en tomas fraccionadas cada 6, 8 ó 12 horas.
 Pantomicina líquida, suspensión 250 mg/5ml, niños 30-50 mg/kg/día según la severidad de la infección, en varias tomas a intervalos de 4-6 ó 12 horas, ó 250 mg cada 6-8 horas.
 Pantomicina intramuscular, 100 mg de etilsuccinato de eritromicina por 2ml, adultos 1 ampolleta cada 4 a 8 horas, o aproximadamente 5-8 mg/kg/día - en inyección intramuscular profunda.
 Pantomicina intramuscular infantil, niños con más de 15 kg de peso corporal 1 ampolleta cada 4 a 8 horas o aprox. 12 mg/kg/día en inyección intramuscular profunda.

2) Nombre comercial: ILOSONE

Formula: Estolato de eritromicina

INDICACIONES: En infecciones del aparato respiratorio superior e inferior, la piel y tejido celular subcutáneo de intensidad leve a moderada, profilaxis a corto plazo contra la endocarditis bacteriana antes de procedimientos dentales u otros procedimientos quirúrgicos; en pacientes con antecedentes de fiebre reumática o cardiopatía congénita y que son alérgicos a la penicilina, en el tratamiento de neumonía atípica primaria causada por *Mycoplasma pneumoniae*, como coadyuvante de la antitoxina, para evitar la aparición de portadores y para erradicar los microorganismos en los portadores de *Corynebacterium diphtheriae*.

CONTRAINDICACIONES: Hipersensibilidad al medicamento.

REACCIONES SECUNDARIAS: Molestias abdominales y, a veces náusea, diarrea y vómito. En el curso de tratamientos prolongados pueden desarrollarse sobreinfecciones por hongos o bacterias no susceptibles; en tal caso debe interrumpirse el antibiótico y tomar las medidas apropiadas. Rara vez se han presentado reacciones alérgicas, como urticaria y otras erupciones cutáneas. Ocasionalmente se han informado reacciones alérgicas graves, incluyendo anafilaxis.

DOSIS Y ADMINISTRACION: La dosis usual es de 250 mg cuatro veces al día o 500 mg cada 12 horas. La dosis usual diaria de un gramo puede aumentarse hasta 4 gramos, según la gravedad de la infección. Niños: la dosis usual es de 20 a 50 mg por kilo de peso por día, dividida en 2, 3 ó 4 tomas, a intervalos regulares. En infecciones más graves, se puede doblar la dosis.

En el tratamiento de infecciones por estreptococo beta-hemolítico, la administración del ILOSONE debe prolongarse hasta 10 días, para reducir la probabilidad de secuelas del tipo de la fiebre reumática o la glomerulonefritis. En la profilaxis de infecciones estreptocócicas en pacientes con fiebre reumática, la dosis es 250 mg dos veces al día.

En la profilaxis de endocarditis bacteriana, el procedimiento recomendado es 500 mg antes de la extracción dentaria o del procedimiento quirúrgico, y 250 mg cada 8 horas por 4 dosis adicionales, en adultos; en niños pequeños, 40 mg por kilo, en dosis divididas, es adecuado.

PRESENTACION: Ilosone cápsulas: Frasco con 12, tabletas frasco con 8, líquido suspensión 125 frasco con 100 ml, líquido 250 suspensión frasco con 60 ml, gotas, polvo para suspensión frasco con 10 ml.

ANTIBIOTICOS A BASE DE LINCOMICINA
(Amplio espectro)

Nombre comercial: LINCOCIN

Fórmula: Clorhidrato de lincomicina

INDICACIONES: Infecciones del tracto respiratorio superior e inferior como: Amigdalitis, bronquitis, laringitis, faringitis, neumonía, sinusitis, otitis, así como también: Heridas infectadas, furunculosis, celulitis, osteomielitis, escarlatina, en que el germen causante sea gram-positivo.

CONTRAINDICACIONES: Hasta en tanto se obtenga mayor experiencia clínica, no se recomienda Lincocin en el recién nacido, en la profilaxis de la recurrencia del reumatismo articular agudo y en pacientes con enfermedades renales, hepáticas, endocrinas o metabólicas preexistentes. Aún cuando no hay evidencia alguna de efectos nocivos tanto para la madre como para el feto, al igual que toda nueva droga, Lincocin deberá usarse con las precauciones debidas en la mujer embarazada. Hipersensibilidad a la droga, infecciones moniliasicas y por hongos.

REACCIONES SECUNDARIAS: Diarrea, ocasionalmente vómito, meteorismo, irritación rectal, vaginitis, urticaria y comezón.

PRESENTACIONES: Lincocin, inyectable, adultos: Frasco-ampula con 2 ml conteniendo clorhidrato de lincomicina monohidratado (equivalente a 600 mg de lincomicina base).

Lincocin, inyectable, pediátrico: Frasco-ampula con 1 ml conteniendo clorhidrato de lincomicina monohidratado (equivalente a 300 mg de lincomicina base).

Lincocin, cápsulas: Cada cápsula contiene clorhidrato de lincomicina monohidratado (equivalente a 500 mg de lincomicina base).

Lincocin, Jarabe: Frasco con 80 ml. Cada 5 ml contiene clorhidrato de lincomicina (equivalente a 50 mg, de lincomicina base).

DOSIS:	Oral	Intramuscular	Intravenoso
<u>Adultos</u>	1 cápsula (500 mg)	600 mg (2ml)	600mg (2ml) cada 8 a
Casos leves	tres veces al día.	c/24 horas	12 hrs, administrar como
Casos graves	1 cápsula (500 mg)	600 mg (2ml)	infusión en 250ml
	cuatro veces al día,	c/12 horas	o + de glucosa al 5% en agua,

	Oral	Intramuscular	Intravenoso
<u>Niños</u>			
Casos leves	30 mg/kg/día en 3 ó 4 dosis igual.	10 mg/kg cada 24 horas	10 a 20 mg/kg/día en 2 ó 3 dosis con 8 a 12 horas de in- tervalo. Administrar como infusión.
Casos graves	60 mg/kg/día en 3 ó 4 dosis igual.	10 mg/kg cada 12 horas	

ANALGESICOS
(A base de Salicilatos)

1) Nombre comercial: ASA 500

Formula: Acido acetilsalicilico en microgránulos recubiertos 0.500g

Tiene una acción analgésica rápida y sostenida durante 6 a 8 horas. Una tolerancia gástrica, que permite su empleo en los casos que requieren un tratamiento prolongado y en pacientes sensibles al ácido acetilsalicilico (úlceras principales). Inocuidad en enfermos cardiacos en los que es de temerse una sobrecarga hidrosalina ya que, contrariamente a las formas solubles del ácido acetilsalicilico, ASA 500 no contiene sodio en la fórmula de sus capas protectoras.

INDICACIONES: Todas las del ácido acetilsalicilico.

CONTRAINDICACIONES: Úlcera péptica activa, gastritis, insuficiencia hepática y/o renal, pacientes hipersensibles al medicamento.

REACCIONES SECUNDARIAS: Su sobredosificación puede ocasionar náusea, vómitos, prostración, erupción cutánea, disuria, anuria, torpeza mental. Inhibición de la adhesividad plaquetaria.

DOSIS: 1 a 2 cápsulas cada 6 u 8 horas.

PRESENTACION: Caja con 20 cápsulas.

2) Nombre comercial: DISPRINA

Formula:	Acido acetilsalicilico	0.300 g
	Carbonato de calcio	0.090 g
	Acido cítrico	0.030 g
	Excipiente c, b, p.	1 tableta

ACCION E INDICACIONES: Por ser soluble en agua, los niveles sanguíneos se alcanzan dos veces más rápido que con ácido acetilsalicilico simple, la absorción y el vaciado gástrico son dos veces más rápidos que con ácido acetilsalicilico simple, disminuyendo la posibilidad de irritación gástrica. Está indicada en reumatismo, neuralgia, lumbago, ciático, dolor de cabeza, dismenorrea, resfriado, gripe, estados febriles; 2 a 3 tabletas cada 4 hrs. Dolor consecutivo a extracciones dentarias, dolor de fracturas, esguinces; 2 a 4 tabletas cada 4 horas.

CONTRAINDICACIONES: Intolerancia a los salicilatos, úlcera gastroduodenal activa, Administrar con precaución a enfermos en tratamiento con anti coagulantes,

REACCIONES SECUNDARIAS; Para la disprina, no se han reportado hasta la fecha,

PRESENTACION: Caja con 24 tabletas.

3) Nombre comercial: DISPRINA JUNIOR

Formula:	Acido acetilsalicílico	81 mg
	Carbonato de sodio	24 mg
	Acido cítrico	8 mg
	Excipiente, c.b.p.	1 tableta

Tiene las mismas indicaciones, contraindicaciones, efectos secundarios, presentación que la Disprina, solo que está se administra a lactantes y niños.

4) Nombre comercial: RHONAL

Formula: Acido acetilsalicílico en gránulos con capa entérica 500mg

Tiene una excelente tolerancia gástrica, lo que le permite ser utilizado en tratamientos prolongados; una absorción más regularizada controlada y prolongada; además carece de ion sodio, por lo que puede administrarse en pacientes sometidos a régimen hiposódico o con sobrecarga hidrosódica.

INDICACIONES: Reumatismos inflamatorios; poliartritis, pelvispondilitis - reumática, reumatismos degenerativos: coxartrosis, gonartrosis. Artralgia, lumbalgia ciática; neuralgias diversas, mialgias, contracturas. Otras indicaciones: Cefaleas persistentes, algias dentarias y padecimientos febriles.

POSOLOGIA: Adultos y niños: 2 a 6 cápsulas c/24 horas. La duración del tratamiento dependerá de la severidad del padecimiento pero, por su excelente tolerancia se puede usar por largo tiempo.

REACCIONES SECUNDARIAS: Corresponde al analgésico antiiprético de mejor tolerancia sin embargo, podrían presentarse efectos colaterales tales como: vértigo, tinnitus, sudoración, náusea y vómito. En pacientes con antecedentes alérgicos puede provocar reacciones alérgicas del tipo: Broncoespasmo y disnea.

CONTRAINDICACIONES: En pacientes con antecedentes de lesión gástrica activa, gastritis o dispepsias o portadores de úlcera duodenal activa, Diccrasias sanguíneas, alargamiento del tiempo de protrombina,

PRESENTACION: Cápsulas dosificadas a 500 mg de ácido acetilsalicílico - en gránulos con capa entérica, caja conteniendo 30 cápsulas,

ANALGESICOS A BASE DE PIRAZOLONAS

1) Nombre comercial: DOLOTANDERII.

Formula: Monohidrato de 1-fenil 2-(p-hidroxifenil)-3,5-dioxo 4 n-butilpirazolidina (oxifenbutazona), 4-hidroxi-acetanilida (paracetamol).

Solución práctica de la fiebre, el dolor y la inflamación, trífada sintomática que siempre acompaña a los procesos infecciosos agudos.

INDICACIONES: Esta indicado en todos los procesos infecciosos agudos como: Infecciones agudas de las vías respiratorias, infecciones ginecológicas, así como en otros procesos no infecciosos como: Traumatismos y en el postoperatorio.

CONTRAINDICACIONES: Úlcera gastroduodenal, leucopenia, diátesis hemorrágicas, hipersensibilidad a los derivados pirazólicos y al paracetamol. En enfermos con trastornos cardíacos, renales, hepáticos graves.

REACCIONES SECUNDARIAS: Se pueden presentar trastornos gastrointestinales y reacciones alérgicas como: Estomatitis, dermatosis de tipo alérgico, herpes labial, máculas eritematosas, urticaria y como todos los pirazólicos puede producir displasia medular. Se debe cuidar su administración en pacientes con estómago sensible, de edad avanzada y en lactantes. Asimismo, no se debe administrar durante el primer trimestre del embarazo.

PRESENTACION: Cápsulas con 75 mg de oxifenbutazona y 300 mg de paracetamol, caja con 24 cápsulas.
Supositorios para adultos con 250 mg de oxifenbutazona y 500 mg de paracetamol, caja con 5 supositorios.
Supositorios para niños con 100 mg de oxifenbutazona y 200 mg de paracetamol, caja con 5 supositorios.

DOSIS: Debe administrarse durante o después de los alimentos.
Adultos: 4 ó 6 cápsulas o bien 2 a 3 supositorios para adultos al día.
Niños de 2 años en adelante; de 1 a 3 supositorios para niños al día.

2) Nombre comercial:

MAGNOPIROL

Formula:	Ampolleta	Comprimido	Supositorio
Fenildimetilpirazolona-me tilaminometanosulfonato de magnesio	2 g	0,5 g	1 g

ACCION E INDICACIONES: Analgésico y espasmolítico. Pre y postoperatorio, Cólicos vesiculares y renales, Algias diversas, inclusive del cáncer, Dolor ginecológico.

POSOLOGIA: Por la vía endovenosa, de preferencia, o intramuscular de 1 a 2 ampolletas a la vez.
Comprimidos: Por la vía oral; De uno a dos comprimidos cada vez, y hasta

seis comprimidos al día.

Supositorios: Por la vía rectal, uno y hasta tres supositorios al día.

PRESENTACION: Cajas de 5 y 50 ampolletas de 5 ml.

Tubos de 10 comprimidos y cartones con 25 sobres de 2 comprimidos cajas con 5 supositorios.

3) Nombre comercial: NEOMELUBRINA

Formula: Fenil-dimetil-pirazolona-metil-aminometasulfonato de sodio

INDICACIONES: Para el tratamiento sintomático de las enfermedades que se acompañan de fiebre, dolor, inflamación, como en gripe, amigdalitis, otitis, faringitis, bronquitis, artritis, osteoartritis, bursitis; traumatismos musculares y articulares: neuralgias, y mialgias de cualquier etiología; para eliminar el dolor en pre y post-operatorio y para potenciar el efecto de los anestésicos locales en odontología y en cirugía menor; cuando se quiera prevenir el dolor en maniobras exploratorias como en ginecología, traumatología y ortopedia. En cualquier padecimiento que curse con fiebre, dolor e inflamación.

CONTRAINDICACIONES: Ulcera gastroduodenal activa, insuficiencia hepática, hepatitis, nefritis, discrasias sanguíneas, insuficiencia cardíaca, oliguria.

REACCIONES SECUNDARIAS: Pueden presentarse náuseas, vómito, urticaria, gastritis, constipación o diarrea.

DOSIS:

Niños de edad escolar:

1 ampolleta de 2 ml de 2 a 3 veces al día, I.M. o I.V. lentamente.

1 comprimido 4 veces al día, 20 gotas 4 veces al día, dos cucharadas 4 veces al día, 1 supositorio adulto 2 veces al día.

Adultos:

1 ó 2 ampolletas de 2 ml 2 veces al día, I.M. o I.V. lentamente.

1 ampolleta de 5 ml 2 veces al día, I.M. o I.V. lentamente

1 ó 2 comprimidos 4 veces al día, 20-40 gotas 4 veces al día.

1 supositorio adulto 3 ó 4 veces al día.

PRESENTACION: Inyectable: Cajas con 5, 10 y 100 ampolletas de 2 ml
Cajas con 5 y 100 ampolletas de 5 ml

Comprimidos: Caja con 10 y 80 comprimidos

Gotas: Frasco con 15 ml y gotero

Jarabe: Frasco con 100 ml.

Supositorios: Caja con 5 supositorios adulto

Caja con 5 supositorios infantil.

RELAJANTES MUSCULARES MAS EMPLEADOS

1) Nombre comercial: ROBAXIN

Formula: Tabletas de 0.5 g de metocarbamol
 Ampolleta de 10 ml con 1 g de metocarbamol

INDICACIONES: Traumatismo agudo neuromuscular, hernia de disco, torceduras, torticolis, dolores secundarios a fracturas o luxaciones, miositis, fibrosis, bursitis, sinovitis.

DOSIS: Adultos: 2 tabletas 4 veces al día o 3 tabletas c/4 horas, de acuerdo con la severidad del espasmo.

Niños: diaria de 50 a 60 mg por cada kg de peso corporal dividida en cuatro o seis tomas.

Ampolletas: I.V. 10 ml máximo 3 ml por minuto.

Para aliviar el espasmo de la musculatura esquelética, suele ser suficiente una ampolleta. Pero en casos más severos puede requerirse de 10 ml cada 8 horas, en ningún caso debe excederse la dosis de 30 ml diariamente por más de tres días consecutivos. Si el estado persiste podrá repetirse, después de un lapso de 48 horas, un curso similar de administración intravenosa.

I.M. 5 ml (1/2 ampolleta) en cada región glútea; repítase a intervalos de 8 horas si es necesario.

CONTRAINDICACIONES: Pacientes con patología renal, hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.

REACCIONES SECUNDARIAS: En algunos pacientes hipersensibles pueden presentarse náuseas, mareos, ligera hipotensión, somnolencia, vértigo y ligeras reacciones alérgicas.

PRESENTACION: Robaxin tabletas, frasco con 30. Ampolletas, caja con 1, 3 ó con 5.

2) Nombre comercial: ROBAXISAL

Formula: Metocarbamol 400 mg
 Acido acetilsalicílico 325 mg

Esta doble acción relajante y analgésica le permite un control más completo del dolor y el espasmo.

INDICACIONES: Reumatismo no articular e inespecífico, mialgias lumbares debidas a golpes, contusiones, esguinces y luxaciones, artritis reumatoide,

CONTRAINDICACIONES: Pacientes con tendencia a sangrado gastrointestinal.

REACCIONES SECUNDARIAS: Inhibe la adhesividad plaquetaria.

DOSIS: Adultos, 2 tabletas 4 veces al día, o 3 tabletas cada 4 horas, de acuerdo con la severidad del espasmo.

Niños: de 270 a 335 mg de metocarbamol por cada 4 1/2 kg de peso corporal, administrada en 4 ó 6 dosis divididas en el día.

PRESENTACION: Frasco con 30 tabletas.

SEDANTES MAS USADOS

1) Nombre comercial: VALIUM

Formula: Contiene como sustancia activa la 7-cloro-1-metil-5-fenil-3H-1-, 4-benzodiazepina-2 (1H)-ona. Se presenta en comprimidos de 2, 5 y 10 mg y jarabe.

INDICACIONES: En general, todos los casos en los que la ansiedad y tensión graves, la excitación ansiosa, la irritabilidad exagerada y los rasgos hipocondríacos y depresivos dominen el cuadro clínico.

En los trastornos del sueño de cualquier gravedad, con excepción de los que tienen origen doloroso. Induce al sueño pero no lo fuerza como un barbitúrico.

Clara acción miorrelajante tanto en los estados espásticos de origen nervioso central, como en las contracturas dolorosas y dolores musculares de origen periférico; síndrome de origen radicular, contracturas reumáticas o artríticas. Facilitación del parto normal.

Trastornos neurovegetativos cardiovasculares: palpitaciones, neurosis cardiacas.

CONTRAINDICACIONES: Insuficiencia hepática y renal, discrasias sanguíneas, embarazo, personas que manejen vehículos y/o aparatos de precisión. Hipersensibilidad a la sustancia.

REACCIONES SECUNDARIAS: Somnolencia, mareo, parestesias, náuseas, vómito, hipotensión, rash cutáneo.

ADMINISTRACION Y POSOLOGIA: Las dosis mencionadas a continuación son aproximadas. Se recomienda administrar a las personas que ejercen un oficio o profesión la dosis principal (5 ó 10 mg o más) por la noche y las dosis débiles (2 ó 5 mg) durante el día. Personas de edad o debilitadas: 2 mg 2 veces al día.

Estados de tensión, excitación y agitación: 10-30 mg al día. Espasmos musculares: 10-30 mg al día. Insomnio: 5-30 por la noche. Partos (período de dilatación del cuello): 20 mg 1-2 veces con 1-2 horas de intervalo.

PRESENTACIONES: Comprimidos blancos de 2 mg; Frascos con 25 y 90. Comprimidos amarillos de 5 mg; Frascos con 25 y 90. Comprimidos azules de 10 mg; Frascos con 20 y 90.

Jarabe (2 mg/5 ml). Frascos con 100 ml.

ANTIINFLAMATORIOS MAS USADOS

1) Nombre comercial: FLANAX

ACCION E INDICACIONES: Es un eficaz antiinflamatorio y antiexudativo - que tiene además la ventaja de ser analgésico y antipirético y de tener una buena tolerancia general. Es de acción rápida: alcanza su nivel plasmático máximo en 30 y 60 minutos.

Esta indicado asociado al antibiótico de elección en enfermedades respiratorias: amigdalitis aguda, bronquitis aguda, faringitis aguda y en general en cualquier proceso infeccioso de las vías respiratorias.

En odontología se puede utilizar en flemones, abscesos dentales, pulpitis, periostitis, periodontitis, gingivitis, estomatitis, pericoronitis, gingivectomías, extracciones dentarias, cirugía maxilofacial.

CONTRAINDICACIONES: Pacientes con síndrome de asma, rinitis o urticaria producidas por el ácido acetilsalicílico, úlcera péptica clínicamente activa. Embarazo, mujeres lactantes, niños menores de un año.

REACCIONES SECUNDARIAS: Es un medicamento bien tolerado aún por pacientes que han presentado gastritis ocasionadas por otros fármacos similares; - sin embargo, se han reportado episodios de sangrado intestinal durante su administración, por lo que no debe usarse en pacientes con úlcera péptica activa o reciente, y en quienes la hayan padecido la vigilancia del médico debe ser estrecha durante el tiempo que reciban Flanax. Se han presentado - dolor o ardor epigástrico, cefalea, trombocitopenia, agranulocitosis e ictericia, que no han sido relacionados directamente con la administración de - Flanax.

PRESENTACIONES: Cápsulas adulto: Caja con 12 cápsulas de 275 mg.

Cápsulas infantil: Caja con 12 cápsulas de 100 mg.

Supositorios infantil caja con 6 supositorios de 50 mg.

DOSIS: Adultos 2 cápsulas para empezar, después una cápsula c/8 horas

Niños mayores de 6 años 1 cápsula infantil c/8 horas.

Niños de 1 a 6 años 1 supositorio infantil cada ocho horas.

2) Nombre comercial: TANDERIL

Formula: Monohidrato de 1-fenil-2-(p-hidroxifenil) 3,5-dioxo-4-n-butilpirazolidina.

ACCION E INDICACIONES: Es antiinflamatorio por ser antiexudativo. Impide la formación del exudado al antagonizar los mediadores químicos responsables del proceso inflamatorio. Está indicado en el tratamiento de procesos inflamatorios y de tumefacciones locales de diversas etiologías. Ejerce, además un efecto analgésico periférico.

Esta indicado en inflamación de las vías respiratorias; por su actividad an-

tiexudativa y antitérmica, es coadyuvante de la antibioterapia específica - en las enfermedades de etiología bacteriana y vírica. Bronquitis, faringitis, neumonías.

Inflamación y tumefacción postraumáticas: Luxaciones, distorsiones, contusiones, fracturas. Pre y posquirúrgico: cirugía de mano, cirugía sobre tendones, reacción quirúrgica de fracturas. Desbridamiento de abscesos. Inflamación en Odontología: Extracciones de piezas dentarias, cirugía.

CONTRAINDICACIONES: Úlcera gastroduodenal, leucopenia, diátesis hemorrágica, hipersensibilidad frente a los derivados pirazolónicos. Hay que tener precaución en los trastornos cardíacos, renales y hepáticos. Insuficiencia hepática, hepatitis, nefritis, glomerulonefritis.

REACCIONES SECUNDARIAS: Da intolerancia gástrica. Para su control se recomienda ingerir las grageas después de los alimentos. Estomatitis, dermatosis de tipo alérgico. Herpes labial, máculas eritematosas, urticaria y como todas las pirazolonas puede producir displasia medular.

DOSIS: 2 grageas, 3 veces al día y después 1 gragea 3 veces al día.
Supositorios: Adultos de 1 a 3 de 250 mg. Niños de 1 a 3 de 100 mg.

PRESENTACION: Caja con 30 grageas de 100 mg. Cajas con 5 supositorios para adultos y para niños.

3) Nombre comercial: VARIDASA

Formula:	Estreptocinasa	10,000 U
	Estreptodornasa	2,500 U
	Excipiente, c.b.p.	1 tableta

Descripción: Producto enzimático obtenido del estreptococo no patógeno tipo Lancefield grupo C.

INDICACIONES: Alivio del dolor, edema y rubor de los procesos inflamatorios, acelera la reabsorción de la sangre extravasada y de los exudados presentes en la región inflamada. En traumas, abscesos tromboflebitis aguda o crónica, celulitis, sinusitis, hematomas, esguinces, fracturas, furúnculos, acné vulgar, otitis, episiotomías. En extracciones dentales únicas o múltiples, pericoronitis, pulpitis.
Si se administra en procesos inflamatorios infecciosos y abscesos debe asociarse con un antibiótico apropiado.

CONTRAINDICACIONES: Enfermedades hemorrágicas, insuficiencia cardíaca congestiva, pancreatitis aguda, trombocitopenia.

REACCIONES SECUNDARIAS: Náuseas, vómito, gastritis, hematuria, erupción cutánea.

DOSIS: Adultos: 1 tableta cuatro veces al día. Niños: 1/2 tabletas cuatro veces al día.

PRESENTACION: Caja con 12 tabletas.

BIBLIOGRAFIA

- 1) ANTIBIOTICS "ADMINISTRATION AND DOSGE"
DRUG-INACTIVATING ENZYMAS OF BACTERIA GROWN IN SUBMINIMAL
INHIBITORY CONCENTRATIONS OF ANTIBIOTICS. GRASSI GG. REV.
INFECTS DIS 1979. SEP-OCT; 1 (5) 852-7
- 2) ANTI-INFLAMATORY AGENTS
ANTIPYRETIC EFFECT OF ACETAMINOPHEN SUPOSITORIOS IN RALS
LOCK A. ET. AL. J. PHARM SCI 1979. SEP 68 (9) 1105-7
- 3) BIRO, CARLOS E.
TERAPEUTICA ANTIMICROBIANA
- 4) DRILL, VICTOR A.
FARMACOLOGIA MEDICA
PRIMERA EDICION, 1974
EDITORIAL PRENSA MEDICA MEXICANA
- 5) GOODMAN, LOUIS S.
GILMAN, ALFRED
BASES FARMACOLOGICAS DE LA TERAPEUTICA
QUINTA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 6) GOTH, ANDRES
FARMACOLOGIA MEDICA
OCTAVA EDICION, 1979
EDITORIAL INTERAMERICANA
- 7) MEYERS, FREDERIK H.
MANUAL DE FARMACOLOGIA CLINICA
TERCERA EDICION 1977
EDITORIAL EL MANUAL MODERNO
- 8) SECRETARIA DE SALUBRIDAD Y ASISTENCIA
CUADRO BASICO DE MEDICAMENTOS DEL SECTOR
PUBLICO,
MEXICO 1979
- 9) URIARTE, VICTOR
PSICOFARMACOLOGIA
PRIMERA EDICION, 1978
EDITORIAL TRILLAS
- 10) INFORMACION PROFESIONAL Y DE SERVICIOS AL ODONTOLOGO
(IPSO)