

149
49



UNIVERSIDAD NACIONAL AUTONOMA DE MEXICO
FACULTAD DE ODONTOLOGIA

ALGUNOS MEDICAMENTOS QUE SE UTILIZAN EN
ODONTOLOGIA

T E S I S

QUE PARA OBTENER EL TITULO DE:
CIRUJANO DENTISTA

P R E S E N T A

CARLOS ISIDRO DEL ANGEL HERRERA

México, D. F.

14434

1979



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.

I N D I C E

SINTESIS	PAGINA	1
PROLOGO		9
ANALGESICOS		10
ANESTESICOS LOCALES		22
ANTIBIOTICOS		34
ANTICOAGULANTES		51
ANTIINFLAMATORIOS		61
BARBITURICOS		67
DIGITALICOS		71
SHOCK		81
REFERENCIAS BIBLIOGRAFICAS (1º)		93

Los últimos 40 años registraron un cambio dramático en la búsqueda de nuevos medicamentos y uno de los principales factores en éste cambio fué la industria farmacéutica. La razón de que la industria sea un factor de importancia, es que se desarrollan hoy en día medicamentos en un proceso muy complicado que requiere más habilidad de lo que puede proporcionar un solo individuo, y una sola disciplina.

Ahora es un trabajo interdisciplinario que requiere químicos, bioquímicos, farmacólogos, microbiólogos, odontólogos, médicos, toxicólogos, farmacéuticos, clínicos y veterinarios que tienen que trabajar íntimamente relacionados y generalmente ésto no es posible en las instituciones académicas.

La fuerza de la investigación en la industria farmacéutica estriba en que pueden conjuntarse, hacia la solución de un problema específico de enfermedad, a expertos científicos en todos estos campos y los apoyan con ayuda, medios, instrumentos y animales en una escala que no está disponible en ningún otro lado.

Tan potente ha sido esta fuerza de la industria, que ha llegado a la situación de ser criticada porque ahora tenemos demasiados medicamentos: se estima que el 90% de las recetas son de medicamentos que se desconocían hace 20 años. Midiendo en términos de años, probablemente el 95% de toda la investigación de medicamentos que se ha llevado a cabo desde los albores de la historia ha tomado lugar después de la segunda guerra mundial. Aunque el conocimiento de la bioquímica en los tejidos vivos y su relación con las actividades farmacodinámicas ha avanzado durante los pasados 40 años, se pueden atribuir muy pocos descubrimientos - -

importantes en terapéutica. Ha sido el enfoque empírico a la quimioterapia, que consiste en someter a " ESCRUTINIO " a los productos químicos y naturales elegidos, lo que es y seguirá siendo posiblemente la mayor fuente de obtención de novedades terapéuticas. La penicilina y los antibióticos que la siguen, así como las sulfonamidas y los antihistamínicos deben su existencia a estos programas de " ESCRUTINIO ".

Por otra parte cuando se descubre actividad biológica en un producto químico natural o sintético, los químicos y los farmacólogos han aprendido que a menudo es posible cambiar su actividad biológica en la dirección deseada modificando la estructura. En los últimos años hemos visto el desarrollo de un alto grado de complejidad por parte de los químicos, diseñando medicamentos eficaces y otros con propiedades totalmente diferentes farmacológicamente, al alterar las estructuras químicas de medicamentos conocidos. La bioquímica ha contribuido mucho al desarrollo de nuevos medicamentos y probablemente tendrá un papel importante y creciente en el futuro en la investigación de nuevos medicamentos. En los casos en los que la fisiología normal y anormal puede delinearse en términos de eventos bioquímicos, una posición racional para atacar a las enfermedades se hace aparente. Una vez que se puede delinear una vía metabólica y bioquímica y sus enzimas asociadas, con los estados anormales y normales del metabolismo pueden buscarse inhibidores para cada una de las reacciones químicas de esta vía metabólica. Con la mejora de las técnicas para el aislamiento de enzimas específicas estas reacciones bioquímicas están siendo estudiadas

in-vitro, en escala creciente para poder encontrar los inhibidores como medicamentos potenciales. De este enfoque ha dado ya por resultado el desarrollo de varios medicamentos útiles. Así la acetazolamida, con acción diurética fué inicialmente descubierta como un inhibidor para la importante enzima anhidrasa carbónica que es responsable del intercambio de reacción entre el bióxido de carbono y el ión bicarbonato. El agente antihipertensivo ampliamente usado, la metildopa, fué sintetizado al estar buscando compuestos que pudieran bloquear la enzima dopa decarboxilase, que es responsable de la conversión de la 3, 4, hidroxifenilalanina a aminas presoras.

En contraste con el enfoque empírico del "ESCRUTINIO" de los nuevos medicamentos, los métodos bioquímicos tienen mucho mayor complejidad científica y mucha mayor brillantez. Sin embargo el primer procedimiento ha sido muy productivo para proporcionarnos nuevos medicamentos así como para extender nuestro conocimiento, y aunque el enfoque bioquímico es estimulante no reemplaza aún el proceso de compuestos relacionados con uno que ya ha demostrado cierta clase de actividad biológica para encontrar el compuesto más útil entre los que se le parecen. Cuando por el resultado del programa de "ESCRUTINIO" o algún otro enfoque los químicos y farmacólogos sienten que han encontrado un compuesto con el potencial para convertirse en una novedad terapéutica, tienen que hacerse un gran número de largas y cansadas investigaciones que implican el trabajo de científicos de muchas disciplinas. En los párrafos que siguen explicaré brevemente algo del trabajo de cada uno de los especialistas en diferentes disciplinas.

En producción: los métodos para producción de suficientes - - cantidades del compuesto primero, deben ser investigados por los científicos. Si el compuesto es sintético esto generalmente implica la evaluación de varias vías de síntesis para encontrar - aquella que sea más económica y más adecuada para la producción en gran escala. Si el compuesto es un producto natural por - - ejemplo un antibiótico, obtenido por fermentación, puede ser - - necesario que se implique el trabajo del genetista para proporcionar mutantes que produzcan organismos que den rendimientos - razonables del antibiótico. Las condiciones de fermentación - deben controlarse perfectamente así como los métodos de purificación pues en muchos casos se necesita que sean muy complejos por la naturaleza lábil de muchos antibióticos.

El trabajo analítico simultáneamente con la fase de producción: Los químicos analíticos deben de trabajar y diseñar métodos para la determinación cuantitativa del compuesto y métodos para la - detección de impurezas. Esto permitirá controlar los estudios de pureza y de estabilidad bajo varias condiciones. Se prepara una monografía del compuesto en la que se describen sus propiedades físicas y químicas además se proporcionan especificaciones - para mostrar los límites a que deben someterse las pruebas físicas y químicas que se describen. Para que pueda ser aprobado el - - compuesto, es por supuesto de mayor importancia que los métodos - analíticos que se proporcionen hagan posible asegurar la pureza - de varios lotes que se empleen en la evaluación del medicamento - y de que estos lotes sean de alta calidad y consistentes.

Solamente si se cumple con ésto será posible obtener resultados confiables de los estudios farmacéuticos, farmacológicos, toxicológicos y químicos. Por ejemplo, pequeñas cantidades de impureza pueden dar lugar a que disminuya la estabilidad, a que aumente la toxicidad o que aumenten los efectos indeseables. Otra tarea para el químico analítico es descubrir métodos para la determinación cuantitativa del compuesto y sus metabolitos en sangre y en tejidos. Tales métodos a menudo tienen que ser muy sensibles porque están presentes en la sangre en concentraciones muy bajas. Para todos estos propósitos hay una variedad de técnicas modernas analíticas que incluyen métodos espectrofotométricos, cromatografía de gases, en papel etc.

Evaluación farmacológica: La evaluación farmacológica de una novedad terapéutica incluye por supuesto una investigación completa de la actividad deseada en modelos experimentales adecuados. Además de ésto es sin embargo necesario estudiar los efectos generales farmacodinámicos para tener una impresión de que clase de efectos secundarios pueden esperarse del medicamento en cuestión. Tales estudios incluyen por ejemplo el efecto en el sistema nervioso central y en el autónomo, los efectos cardio vasculares, los efectos en el tracto gastrointestinal etc.

Una parte muy importante de la evaluación farmacológica es el estudio de la farmacocinética del medicamento. Esto incluye un estudio de absorción y distribución en varios órganos, determinación de los niveles en sangre y en tejidos que se obtienen después de varias dosis, metabolismo, eliminación, vida media etc. Para llevar a cabo tales estudios es a menudo necesario trabajar con

compuestos radioactivos. Los isótopos más frecuentemente - - -
empleados para marcar los medicamentos son el carbono catorce -
y el tritio y puede requerirse mucha habilidad por parte de - -
los químicos sintéticos para que proporcionen material especí- -
ficamente marcado que se requiere por los farmacólogos. Evaluación
toxicológica: Las investigaciones toxicológicas de una novedad -
terapéutica empieza con la determinación de la toxicidad aguda -
la que se da en la forma de valores de dosis letal media.

Los valores de dosis letal media se determinan en varias especies,
normalmente ratones y ratas y después de emplear varias vías de -
administración como son oral, intramuscular, intravenosa. En las
de toxicidad crónica el compuesto se administra diariamente por -
un largo tiempo a los animales de experimentación. Por cuánto -
el medicamento debe administrarse, depende por supuesto de la - -
naturaleza del mismo.

Para un antibiótico por ejemplo que normalmente se administrará
a los pacientes por un período relativamente corto digamos por -
dos semanas, los estudios que se hagan durante tres meses se - -
consideran suficientes y son aceptados por la mayoría de las - -
autoridades sanitarias en todos países. Para los medicamentos -
como los antihipertensivos o los medicamentos antidiabéticos - -
que se van administrar por largos períodos, se requieren estudi
os que tarden de 6 a 12 meses. La toxicidad crónica generalmente
se realiza en dos especies, como regla se escogen ratas y perros.
se dan normalmente tres diferentes niveles de dosis, la mayor de
estas dosis es preferentemente tan alta que da lugar a que aparezcan
los efectos tóxicos y nos revelen que clase de toxicidad puede - -

esperarse del medicamento en cuestión. La dosis más baja debe ser en el mismo orden de magnitud que la más alta dosis terapéutica calculada en miligramos por kilo de peso.

Durante la dosificación se registran cuidadosamente un número: de parámetros como son el peso ganado, el análisis de la sangre la función del hígado, del riñón etc. Cuando la dosificación se termine, los animales son sacrificados y se examinan los órganos macroscópica y microscópicamente por los patólogos calificados. Además de los estudios normales de largo tiempo se hacen investigaciones que puedan revelar posibles efectos teratogénicos y en algunos casos se diseñan estudios para saber si el compuesto es carcinogénico o tiene propiedades mutagénicas. Formulación antes de que un nuevo medicamento esté listo para una prueba clínica es por supuesto necesario encontrar una forma de dosificación conveniente, nosotros la llamamos forma farmacéutica. Esto a menudo presenta muchos problemas e implica un trabajo de investigación extenso y costoso, solamente quisiera señalar que una buena formulación puede ser de importancia decisiva para el éxito del medicamento porque hay factores esenciales como la biodisponibilidad, la tolerabilidad, la estabilidad que depende en gran parte de la forma farmacéutica. Espero que este bosquejo les haya dado a ustedes una impresión del trabajo que se requiere hoy día para poder introducir en el mercado una novedad terapéutica. De acuerdo a las estadísticas recientes, un promedio de más de tres mil compuestos tienen que sintetizarse y estudiarse por "SCRUTINIO" para encontrar uno que pueda pasar los muchos obstáculos descritos y llegar a ser una especialidad farmacéutica.

Durante los años recientes hemos sido testigos de demandas crecientes de investigación por parte de las autoridades sanitarias y esto por supuesto ha conducido a una elevación del costo de producción.

Hoy día no es raro que el costo de introducir una novedad terapéutica en los Estados Unidos ascienda a varios millones de dólares. Es obvio que este desarrollo es peligroso por que muchos proyectos que parecen provisorios no se llevaron a cabo por la razón de que grandes compañías valoran cuidadosamente, el criterio riesgo-beneficio antes de decir si hacen o no las altas inversiones que se requieren.

A la larga esto afectará la investigación de medicamentos y podemos esperar que será posible encontrar un balance afortunado entre los requisitos de las autoridades sanitarias y aquello que es medicamento esencial y practicable. Si ésto se lograra se cree que la Industria Farmacéutica será capaz también en el futuro como hasta ahora, de hacer contribuciones importantes para combatir las enfermedades.

P R O L O G O

Resulta innecesario describir todos los fármacos que han tenido y siguen teniendo utilidad en odontología, por lo que en este trabajo se hace mención de los empleados en la actualidad. Por otra parte existen limitaciones debido a que el criterio del estudiante no se ha formado por que no ha tenido experiencia con todos los medicamentos, éste se norma con el de otras personas o con el de los autores de los libros de consulta, con el consiguiente resultado de no coincidir siempre por los diferentes puntos de vista.

Sin embargo, se intenta dar una descripción general de los fármacos más conocidos y señalar sus defectos, ventajas y desventajas, tocándole al cirujano dentista la selección del o de los que considere de mayor utilidad.

Importa por lo tanto hacer notar que esta tesis no dictamina la substancia que debe emplearse en un caso determinado, sino que enumera un grupo de productos que para ese mismo caso pudieran dar los efectos buscados.

A N A L G E S I C O S

NORMAS PARA EL USO CLINICO DE LOS ANALGESICOS

En general, un medicamento puede modificar la sensación de dolor:

Eliminando el estímulo doloroso; cuando un agente quimioterápico ejerce acción bactericida en un absceso, cuando una droga -- anticolinérgica suprime el espasmo doloroso del tubo digestivo, cuando un vasodilatador mejora la oxigenación del miocardio -- durante un espasmo de las coronarias, cuando un alcalino neutraliza el jugo gástrico en un sujeto con úlcera péptica, o cuando un corticosteroide modifica el estado inflamatorio de una artritis reumatoide (5, 6 , 7).

Interrumpiendo la conducción nerviosa de los estímulos dolorosos como lo hacen los anestésicos locales infiltrados en la zona - dolorosa o inyectados en la cercanía de los troncos nerviosos - que llevan las fibras aferentes, o como lo hacen los contrairritantes, que, estimulando terminaciones cutáneas, ocupan vías - comunes a estímulos dolorosos de zonas profundas y excluyen parcialmente a estos estímulos.

Suprimiendo las respuestas reflejas a estímulos dolorosos, como en el caso de la Mefenesina, que, al inhibir la actividad refleja de la médula espinal, disminuye los espasmos del músculo esquelético.

Reduciendo la percepción central de los estímulos dolorosos por acción sobre las representaciones centrales de las vías dolorosas o quizá, por supresión de estímulos centrífugos que facilitan la transmisión aferente.

Alterando la reacción de los estímulos dolorosos sin suprimir la llegada de éstos a la zonas de integración superior, y sin deprimir el reconocimiento del estímulo, en forma que estaría relacionada a las modificaciones en la reacción al dolor que resulta del temperamento, del estado de ánimo del enfermo o de la sugestión inmediata.

Por depresión general del sistema nervioso central, mecanismo que es evidente en la depresión profunda que acompaña al uso de los anestésicos generales y que puede ser operante - aún en la depresión moderada.

En su connotación más amplia, el término analgésico se refiere a toda sustancia capaz de aliviar el dolor, sea cual fuere el mecanismo que pone en juego. En su connotación más estrecha, se refiere a aquellos que lo logran fundamentalmente por reducción en la percepción central del dolor, sin suprimir la causa etiogénica mediata o inmediata. Las drogas que llenan este requerimiento son miembros de uno de los grupos de medicamentos.

Los analgésicos-antipiréticos. Aún cuando el grupo incluye sustancias de estructura química diversa, todas comparten la peculiar característica de producir simultáneamente - acción analgésica y antipirética, y todas son efectivas - en el tratamiento de los mismos tipos de dolor. Se cree que reduzcan la percepción central de los estímulos dolorosos, - pero existe la posibilidad de que obren también por un efecto directo sobre las zonas dolorosas o estimulando la producción de corticoides suprarrenales, que ejercen entonces efectos -

antiinflamatorios. El grupo incluye los derivados del ácido salicílico (aspirina, salicilato de sodio, salicilamida y - otros), los derivados de la anilina (acetofenetidina, acetanilida), los derivados de la pirazolona (aminopirina, dipirona, fenilbutazona) y los derivados del ácido cinconínico (cincofeno).

Como todas estas sustancias poseen alguna acción uricolítica, se suele incluir en el grupo de la colchicina, alcaloide no analgésico que modifica profundamente el metabolismo del ácido úrico y que es muy efectivo en el tratamiento de la gota.

Analgésicos narcóticos que producen hábito. Este grupo también incluye sustancias de estructura química muy diversa, pero semejantes en que el efecto analgésico, más intenso que el del grupo anterior, coexiste con la capacidad para deprimir el sistema nervioso central, producir un tipo de euforia peculiar y llegar a provocar el desarrollo de hábito cuando se repite su administración. Se cree que también obren reduciendo la percepción central de los estímulos dolorosos, además los cambios que producen en la reacción afectiva al dolor y su capacidad de producir depresión general del sistema nervioso central. El término narcótico se aplica a esta mezcla peculiar de efectos analgésicos e hipnóticos, pero puede también calificarse otras sustancias de uso reclamado en la ley de narcóticos.

El grupo incluye los alcaloides fenantrénicos del opio (morfina, codeína) derivados semisintéticos de estos alcaloides (metopon, dilaudid), derivados sintéticos de la morfina -

(levorfan) derivados de la piperidina (meperidina, anileridina) y derivados de la heptanona (metadona) se tratan en este capítulo algunos derivados de la morfina, como la apomorfina y la nalorfina, que no son estrictamente analgésicos, aun cuando no carecen del todo de esta acción.

Es interesante el que la intensa actividad química y farmacológica llevada a cabo en busca de analgésicos nuevos no haya roto el esquema peculiar conocido para las sustancias usuales. - Particularmente, no ha sido posible encontrar una sustancia que posea acción analgésica intensa del tipo de la morfina y que carezca de tendencia a producir hábito.

El dextropropoxifeno representa un progreso en esa dirección --, pero es un analgésico de acción moderada.

La selección de analgésicos para uso clínico suele complicarse por la dificultad de valoración de los analgésicos en animales de experimentación, así como la interpretación de los resultados de estudios clínicos que se derivan de casuística insuficiente y de diseños estadísticos inadecuados; por el hecho de que los estudios clínicos suelen hacerse para probar la efectividad de una droga específica, o de mezclas concretas de ellos, y no incluyen representantes de los diversos grupos farmacológicos. Además mucha información llega al médico conciente o inconcientemente por la propaganda comercial y por la limitación al uso de algunos analgésicos por disposiciones legales para la distribución de narcóticos.

Las consideraciones más importantes para esta selección se derivan de la susceptibilidad de los diversos tipos de dolor a

los agentes disponibles, del riesgo de producir fenómenos tóxicos agudos o crónicos por el uso de los analgésicos y de la posibilidad de provocar el desarrollo de hábito.

Sugerimos, como normas generales en la elección de un analgésico, las siguientes:

Preferir siempre un analgésico de grupo de los analgésicos-antipiréticos, una mezcla de diversos miembros de este grupo, o una combinación de ellos con sedantes del sistema nervioso central, en vez de las que producen hábito.

Entre los analgésicos antipiréticos dar preferencia a los diversos grupos en el siguiente orden: derivados del ácido salicílico, derivados de la anilina, derivados de la pirazolona, derivados del ácido cinconínico.

Una vez decidido el grupo, seleccionar la sustancia menos tóxica.

Si el dolor no puede aliviarse con un analgésico-antipirético y se quiere usar un analgésico narcótico, dar preferencia a los diversos grupos en el siguiente orden: codeína y sustancias análogas incluyendo el dextropropoxifeno, meperidina y sus derivados; morfina y sustancias análogas, incluyendo la metadona.

Cuando se utiliza un analgésico narcótico, un derivado de la anilina o un derivado de la pirazolona, usarlo por el menor tiempo posible.

Preferir siempre la administración oral.

A continuación se enumeran algunos tipos frecuentes de dolor y se menciona su susceptibilidad a los analgésicos.

Dolores de las articulaciones, de los tendones y de las cu-

biertas musculares.

Este tipo de dolor, extraordinariamente frecuente como problema médico, puede tratarse con los diversos analgésicos-antipiréticos, que además de disminuir la percepción central al dolor, - ejercen efectos antiinflamatorios que son importantes en algunas de estas alteraciones clínicas.

Dolores de las cubiertas nerviosas.

Las cefaleas comunes y la neuralgias ordinariamente ceden a la acción de los salicilatos, sin embargo, hay ocasiones en que - tienen que ser tratadas con pirazolonas combinadas con hipnóticos o con sustancias del tipo de la codeína.

Dolores de las Serosas.

Los dolores que resultan de procesos inflamatorios en el peritoneo, la pleura, y el pericardio suelen requerir analgésicos - del tipo de la codeína y ocasionalmente, del tipo de la morfina. Los dolores por distensión.

La distensión de las paredes de las vísceras huecas se tratan usualmente con antiespasmódicos. En ocasiones se requiere el - uso adicional de analgésicos, especialmente cuando se trata de cólicos renales o biliares.

En estos casos, se suele usar la meperidina o alguno de sus derivados, ya que las sustancias del tipo de la morfina aumentan el espasmo muscular.

Dolores por anoxia.

La isquemia que resulta del espasmo o de la oclusión vascular - se acompaña de dolor intenso en la zona privada de circulación. Este tipo de dolor se trata con agentes vasodiladores y con -

anticoagulantes, pero suele requerir analgésicos del tipo de la morfina.

Dolores por invasión o lesión tisular.

Son ejemplos de este tipo de dolor los que resultan como consecuencia de las quemaduras, durante el postoperatorio, como resultado de trauma a los huesos y tendones y en el curso de las enfermedades neoplásicas.

Estos dolores suelen requerir analgésicos del tipo de la meperidina o de la morfina.

Dolor del trabajo del parto.

El dolor intenso del trabajo del parto requiere analgésicos de gran efectividad que no depriman el centro respiratorio del recién nacido. Las sustancias más útiles son la meperidina y sus derivados.

ANALGESICOS ANTIPIRETIICOS

DERIVADOS DEL ACIDO SALICILICO

Acido Acetilsalicílico (Aspirina)

Salicilato de Sodio

Salicilamida

Salicilato de metilo

Acido Salicílico

Acido Salicilsalicílico

DERIVADOS DE ANILINA

Acetofenitidina

Acetanilida

DERIVADOS DE LA PIRAZOLONA

Aminopirina
Antipirina
Dipirona
Fenilbutazona

DERIVADOS DEL ACIDO CINCONINICO

Cincófono
Neocincófono
Alcaloides naturales
Colchicina

ANALGESICOS QUE PRODUCEN HABITU

ALCALOIDES DEL OPIO

Morfina
Codeína (Metilmorfina)

DERIVADOS SINTETICOS DE LA MORFINA

Metildihidromorfinona
Diacetilmorfina
Dihidromorfinona
Levorfán
Etilmorfina
Dihidrocodeinona
Dihidrocodeína
Apomorfina
Nalorfina

DERIVADOS DE PIPERIDINA

Meperidina
Anileridina
Alfaprodina

DERIVADOS DE HEPTANONA

Metadona
Isometadona

ANALGESICOS NO SALICILICOS:

AMINOPIRINA: Algunos derivados de la fenilpirazolona, como la aminopirina y su predecesor la antipirina, se utilizaron mucho en su tiempo como analgésicos y antipiréticos. La antipirina se ha abandonado casi totalmente por que los salicilatos ejercen prácticamente la misma acción benéfica sin producir sensibilización notable.

En la actualidad, el único interés por la antipirina se relaciona con la investigación experimental en las cuales pueden utilizarse antipirina o su derivado N-acetil -4-amino antipirina para medir el volumen del agua corporal total.

Aunque la aminopirina es antipirética, analgésica y anti-reumática ha causado agranulocitosis en un número importante de pacientes. En consecuencia y dada la mayor seguridad de otros analgésicos, no hay motivo para prescribir la aminopirina (5,6,7).

FENILBUTAZONA:

La fenilbutazona, congénere de la antipirina y la aminopirina, comenzó a usarse en 1949 para el tratamiento de la artritis reumatoide y transtornos semejantes. Aunque es un fármaco eficaz, su toxicidad limita mucho su uso.

PROPIEDADES FARMACOLOGICAS:

Efectos antiinflamatorios. La fenilbutazona es semejante a los corticoesteroides en su actividad, en modelos experimentales. En el hombre los efectos antiinflamatorios de la fenilbutazona se modifican en la artritis reumatoide y en transtornos afines. No se conoce el mecanismo del efecto antiinflamatorio.

se cree que el fármaco tiene efecto local semejante al de los salicilatos, probablemente disminuyendo la permeabilidad capilar.

PREPARADOS Y DOSIS:

La Fenilbutazona es un polvo blanco de sabor algo amargo - se expende en tabletas de 200 mg. para administración oral. - La dosis es variable, pero generalmente basta de 200 a 600 mg. diarios para lograr efectos terapéuticos máximos.

Dosis mayores no tienen gran eficacia, solo aumentan la toxicidad. Deben tomarse con los alimentos para disminuir la irritación gástrica.

NUEVAS DROGAS:

INDOMETACINA: Es muy eficaz en la artritis. Sin embargo puede producir úlcera péptica, cefalea, trastornos hematológicos y otros efectos secundarios, que quizá limiten su utilidad se administra por vía oral en dosis de 25 mg. dos o tres veces al día.

ACIDO FLUFENAMICO: Es otro medicamento antiinflamatorio nuevo y potente todavía no conocemos cual sea su verdadero lugar en terapéutica. Se utilizan dosis de 300 mg. por vía oral.

El ácido mefenámico, muy similar, no parece tener ventaja sobre la aspirina.

ANALGESICOS: QUE SE DIVIDEN EN:

NARCOTICOS

NO NARCOTICOS

NARCOTICOS:

Sus características son producir alivio del dolor y sueño, las drogas pueden aliviar el dolor por diferentes mecanismos. Las drogas espasmolíticas al producir relajación del músculo liso pueden suprimir ciertos dolores debidos a espasmos del mismo.

Pero existen sustancias que tienen la propiedad de suprimir el dolor al actuar directamente sobre el S.N.C. deprimiendo los centros correspondientes. (5, 6 y 7).

ALCALOIDES DEL OPIO		
CLASE	ALCALOIDE NATURAL	PORCENTAJE EN EL OPIO.
FENANTRENO	MORFINA	10.0
	CODEINA	0.5
	TEBAINA	0.2
BENCILISOQUINOLINA	PAPEVERINA	1.0
	NOSCAPINA	6.0

HISTORIA DE ALGUNOS ANALGESICOS.

Los antiguos sumerios, debieron conocer los efectos psicológicos del opio, pues sus ideograma para la adormidera era hul -- ("qoso") más gil ("Plantas "), pero sin duda la primera referencia acerca del jugo de la adormidera se encuentra en los escritos de Teofrasto en el siglo III A.C.

La palabra opio proviene del nombre griego que significa, jugo. La sustancia se obtiene del jugo de las cápsulas de adormidera

Los médicos árabes conocían los usos del opio y los mercaderes árabes llevaron la droga al oriente y a China, donde se empleó principalmente para controlar la disenterfa. A mitad del siglo XVI, algunos usos del opio que aún hoy son válidos se conocían bien en Europa. Se atribuye a Paracelso (1493-1541) la elaboración del "Íudano" que aún se usa en nuestros días.

En el siglo XVIII fumar se hizo popular en Oriente, el uso de los opiáceos era mucho más aceptado por sus efectos subjetivos que en la actualidad.

En 1803 un joven alemán farmacéutico, Sertürner, aisló y descubrió un alcaloide del opio al que llamó MORFINA refiriéndose a morfeo, Dios griego del sueño. Poco después se descubrieron otros alcaloides del opio, la codeína por Robiquet en 1832, la papaverina por Jerck 1848, y a la mitad del siglo XIX había comenzado a extenderse en el mundo médico el uso de alcaloides puros.

NO NARCÓTICOS:

Son los que provocan descenso térmico y no son drogas de adicción.

Los salicilatos alivian ciertos dolores por acción en el S. N. C. cuyo mecanismo de acción no se ha comprobado. Además, producen un efecto en quimioceptores periféricos, se cree que su acción es subcortical. Puesto que su dosis analgésicas no causan trastornos mentales, hipnosis o alteraciones en forma de sensibilidad distinta al dolor. Tampoco afectan a las vías reticulares por lo que se despierta y se domina la atención, adecuada por el dolor.

Los dolores que pueden aliviarse por los salicilatos son - los de poca intensidad, de origen circunscrito o disperso. Sobre todo, los salicilatos sirven en el dolor de cabeza, las - - mialgias, las artralgias y otros dolores en las estructuras tegumentarias pero no de los que emanan de las visceras.

ANESTESICOS LOCALES.

Los anestésicos locales son fármacos que son capaces de - bloquear la conducción nerviosa en cuanto se aplican en el tejido nervioso en concentración adecuada. Actúan en cualquier parte del sistema nervioso, por ejemplo. Cuando se aplican en la corteza motora, desaparece la transmisión del impulso que proviene de esta área, cuando se inyecta en la piel, impide la iniciación y la transmisión de los impulsos sensitivos. Un anestésico local, en contacto con un tronco nervioso causa parálisis - sensitiva y motora en el área que tal tronco inerva. Muchos compuestos obstaculizan la conducción y a menudo dañan - en forma permanente a la neuronas. La gran ventaja práctica de los anestésicos locales es que su acción es reversible, su uso es seguido de recuperación completa de la función nerviosa sin que queden huellas de lesión estructural de las fibras o las - neuronas (5, 6, 7, 14).

PROPIEDADES DE UN ANESTESICO IDEAL:

La droga no ha de producir hábito, tolerancia, ni adicción. Debe de aliviar todo tipo de dolor en forma efectiva y selectiva. No ha de producir sedación y muy poca euforia. Su duración de acción debe ser adecuada.

No debe producir acciones colaterales sobre la respiración, sistema cardiovascular y gastrointestinal.

Debe tener un amplio margen de seguridad.

La droga ha de actuar tanto oral como parenteralmente.

Debe ser estable, barata y agradable de tomar.

Ha de poder utilizarse sin peligros en obstetricia y como medicación preanestésica.

El primer anestésico local descubierto fué la cocaína, alcaloide que en gran cantidad (0.6 a 1.8 de 100%) poseen las hojas de Erythroxylon coca, arbusto que crece en las montañas de los andes entre 450 y 1800 m. de altitud.

El alcaloide puro fué aislado por primera vez por NIEMANN - discípulo de WOHLER, quién notó que tenía sabor amargo y producía un efecto peculiar en la lengua, adormecía y casi la privaba de toda sensibilidad, VONANREP, en 1880, estudió sus cualidades farmacológicas y observó que, cuando se infiltraba cocaína por vía subcutánea, la piel se volvía insensible al pinchazo del alfiler.

Así con el trabajo de EINHORN y colaboradores efectuado en 1892 comenzó la investigación química de los substitutos sintéticos de la cocaína. De esto resultó en 1909, la síntesis de la procaína, anestesia que actualmente se usa mucho.

La investigación química continuará, por que no se ha descubierto el anestésico local ideal que carezca de efectos indeseables. (5, 6, 7 y 14)

PROPIEDADES DESEABLES DE LOS ANESTESICOS LOCALES:

No debe ser irritante el tejido en que se aplique.

No causar lesión permanente de las estructuras del nervio.

Su toxicidad general debe ser baja.

Debe ser eficaz por inyección en el tejido y por aplicación, tópica en las mucosas.

El tiempo para que produzca la anestesia sea el más corto posible.

El efecto debe ser lo suficientemente duradero para que permita efectuar el acto quirúrgico planeado, pero no tan largo que prolongue la recuperación.

Un anestésico local debe ser hidrosoluble y estable.

Debe poderse esterilizar.

ANESTESICOS USADOS EN LA ACTUALIDAD.

CLORHIDRATO DE COCAINA.

CLORHIDRATO DE PROCAINA.

CLORHIDRATO DE CLOROPROCAINA.

CLORHIDRATO DE DIBUCAINA.

CLORHIDRATO DE LIDOCAINA.

CLORHIDRATO DE MEPIVACAINA.

CLORHIDRATO DE PIPEROCAINA.

CLORHIDRATO DE PRILOCAINA.

CLORHIDRATO DE TETRACAINA.

CLORHIDRATO DE COCAINA. Es el preparado oficial del alcaloide, un polvo cristalino blanco. El alcaloide base se disuelve bien en los disolventes orgánicos; el clorhidrato es soluble en agua. La cocaína no se ingiere ni se inyecta. Las soluciones que se emplean en clínica para anestesia superfi-

cial varfan de 1.0 a 4.0 % (córnea) y de 10 a 20% (nariz y garganta), según la mucosa que se vaya a anestésiar. En estas soluciones se añade adrenalina.

CLORHIDRATO DE PROCAINA:

Es un polvo cristalino blanco bastante soluble en agua. - El preparado oficial es la solución inyectable de clorhidrato de Procaína U.S.P. Los preparados del mercado tienen las siguientes presentaciones: Ampolletas o Frascos ampula con solución al 1 ó 2% con Adrenalina o sin ella, para infiltración y bloqueo de nervios.

CLORHIDRATO DE CLOROPROCAINA.

Es un derivado halogenado de la Procaína y tiene casi todas las propiedades farmacológicas de esta substancia. Su potencia anestésica es al menos el doble y su toxicidad es menor que la Procaína. El Clorhidrato de la Cloroprocaína se presenta en solución inyectable (1.0 y 2.0 %).

CLORHIDRATO DE DIBUCAINA:

Es un derivado quinolinico. Es el más potente, el más tóxico y el de acción más duradera de los anestésicos locales comúnmente empleados. Tiene más o menos 15 veces más potencia y toxicidad que la Procaína y aproximadamente triple duración de la acción anestésica. El clorhidrato de Dibucaína (con Adrenalina) ya no se usa para anestesia por inyección. Se emplea anestesia tópica en la solución de 0.1 a 2.0 % solución de 0.25 a 0.2 % y la pomada al 0.5 %.

CLORHIDRATO DE LIDOCAINA.

Es un anestésico potente que se usa mucho para inyección o tópica produce anestesia más rápida, más intensa, de mayor dura-

ción y más extensa que la procaína en concentración igual. La Lidocaína tiene la misma toxicidad que la Procaína cuando se administra por la vía subcutánea en solución al 0.5% inyectada en solución a 2.0% es más tóxica que la procaína. Es más estable y no es irritante. La solución de Lidocaína es adecuada para efectuar anestesia por infiltración en concentraciones de 0.5% tópicamente para producir anestesia en las mucosas, de 1.0 a 2.0% es eficaz cuando no se usa como vaso constrictor, pero en esta forma aumenta su absorción y toxicidad y disminuye la duración. Sin embargo, parece el anestésico de elección para las personas hipersensibles a la adrenalina o sus congéneres. También puede ser el anestésico de elección a las personas sensibles a la procaína. Un notable efecto secundario de la lidocaína es la somnolencia.

CLORHIDRATO DE MEPIVACAÍNA

Es un anestésico local del tipo de las amidas introducido recientemente a 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 ella. Se ha empleado para la anestesia por infiltración, anestesia regional por bloqueo nervioso y anestesia raquídea. El clorhidrato de Mepivacaína se emplea en soluciones inyectables al 1.0 y 2.0 %.

CLORHIDRATO DE PIPEROCAÍNA.

Es un éster del ácido benzoico y una etanolamina cuyo átomo de nitrógeno se encuentra en un anillo de metilpiperidina. Es aproximadamente tres veces más tóxico que la procaína cuando se

administra por la vía venosa, pero por vía subcutánea su toxicidad es más o menos la misma que la de la procaina. Las dos sustancias tienen aproximadamente igual potencia anestésica. El clorhidrato de piperocaína se usa para producir anestesia tópica en la forma siguiente: Córnea, solución al 2.0%, pomada oftálmica al 4.0%, nariz y garganta, solución al 1.0 al 4.0%, para producir anestesia por bloqueo de nervio 0.5 a 1.0%.

CLORHIDRATO DE PRILOCAINA.

Es un anestésico local de tipo amida. Sus propiedades farmacológicas son semejantes a la lidocaína, a la que se parece químicamente. Tiene un comienzo de acción más lento, pero la acción es más duradera. Como la lidocaína, puede producir somnolencia. In efecto tóxico singular es la metahemoglobinemia. Se ha empleado en anestesia por infiltración. Anestesia regional por bloqueo. Se presenta en soluciones inyectables al 1.0, 2.0, 3.0%.

CLORHIDRATO DE TETRACAINA.

Es un derivado de ácido para-aminobenzoico en el que el butilo ha substituido a uno de los hidrógenos del grupo amino. La tetracaína es aproximadamente 10 veces más tóxica y más activa que la procaina, por vía venosa sirve para todos los fines de anestesia. Para anestesia tópica oftálmica se emplea en solución al 0.5% para anestesia de nariz y de garganta en solución al 2.0%, en anestesia pararaquídea una dosis total de 10 a 20 mg. es suficiente.

ANESTESICOS TOPICOS.

PASTA DESENSIBILIZANTE

COMPOSICION: Pasta dental desensibilizante y antiséptica, que contiene diversas sales de calcio, magnesio, sodio, potasio, - junto con formalina al 1.4% sulfato de calcio precipitado y un agente para darle buen sabor.

ACCION E INTERACCIONES: La pasta desensibilizante está indicada para reducir la hipersensibilidad dental dolorosa causada por estímulos externos tales como los térmicos (aire, líquidos y alimentos calientes o fríos), químicos (dulces, ácidos) y mecánicos (contacto con instrumentos dentales), en toda la - - patología bucal en donde requiera acción desensibilizante y antisépticos.

CONTRAINDICACIONES: No se conocen hasta la fecha.

REACCIONES SECUNDARIAS: Puede incrementarse la sensibilidad durante los primeros días de tratamiento, pero ésta desaparece - después de algunos días de un cepillado regular.

ADMINISTRACION Y POSOLOGIA: En general se logra notable mejoría o la eliminación de la hipersensibilidad, después de usarla de una a tres semanas.

PRESENTACION: Tubo conteniendo 60 g. (4).

ANTISEPTICO BUCOFARINGEO

FORMULA:

Diclorhidrato de clorhixidina	0.005 g
Benzocaina	0.002 g
Excipiente aromatizado c.b.p.	1,200 g

INDICACIONES:

Tratamiento de infecciones de boca y garganta, antes y después -

de tonsilectomias y extracciones dentales para prevenir posibles infecciones secundarias.

VENTAJAS:

Poderosa acción bactericida contra gérmenes gram positivos y gram negativos. No hay resistencia de desarrollo a algún tipo de germen ni se ha podido observar esto " in vitro ".

CONTRAINDICACIONES:

Casos de hipersensibilidad.

REACCIONES SECUNDARIAS:

La bibliografía internacional y local no ha reportado efectos colaterales con la administración del fármaco.

PRESENTACION:

Cajas de 12 trociscos con 5 mg. (4).

SUERODENT-T

FORMULA: Cada ml. contiene.

Clorhidrato de lidocaína	0.005 g
Acido Nicotínico	0.002 g
Vehículo, c.b.p.	1ml

INDICACIONES:

El producto SUERODENT-T esta indicado en el tratamiento de las molestias que se presentan durante la salida de los dientes en los niños en la primera dentición.

CONTRAINDICACIONES:

No se conocen hasta la fecha.

REACCIONES SECUNDARIAS:

A dosis terapéuticas se desconocen hasta la fecha.

TOXICIDAD:

Atóxico: No altera el apetito ni el estado general. No produce ninguna reacción.

POSOLOGIA:

La frecuencia con que se aplique queda a juicio del médico, pero como promedio se recomienda aplicar una o dos gotas en el dedo - haciendo masaje sobre las encías. Repítase varias veces al día hasta lograr la tranquilidad del niño.

PRESENTACION:

Frasco con 10 ml.

XYLOCAINA: (lidocaina)

Clorhidrato de 2 - dietilamino-2, 6-acetoxilidida.

También es conocida como LIDOCAINE O LIGNOCAINE

ACCION DE INTERACCION:

XYLOCAINA reúne varias propiedades que no se encuentran en otros anestésicos. Su período de iniciación anestésica (latencia) es muy breve. La extensión y profundidad es dos a tres veces mayor que la que producen los anestésicos procaínicos. Variando su - concentración, volumen y contenido del vasoconstrictor se puede - controlar la duración, dentro de límites muy amplios; xylocainas aplicada sobre mucosas heridas, etc. también constituye, un - excelente anestésico tópico. A diferencia de los derivados del - ácido paraaminobenzoico, carece de efectos alérgicos, además - del campo propio del anestésiflogo, la xylocaina tiene múltiples indicaciones en otras especialidades.

En anestesia por infiltración de los segmentos distales (sin - épinefrina).

ODONTOLOGIA: Anestesia dental y cirugía bucal (2.5) anestesia tópica bucal (7.8).

CONTRAINDICACIONES:

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

REACCIONES SECUNDARIAS:

Con sobre dosificaciones en personas hipersensibles pueden presentarse mareos, escalofrío, nerviosidad y náuseas. (4)

PRESENTACION:

Cartuchos dentales al 1 y 2" con epinefrina

Cartuchos dentales al 2" con epinefrina 100,000

Spray dental al 10" (con sabor) en frasco aerosol de 80 g.

Spray dental al 10" en frasco aerosol de 80 g.

Ungüento al 5" tubos con 10 y 35 g. Tarro con 50 g.

Tableta al 2".

RUCAINA L. R. Y RUCAINA N. S. (Anestésicos locales)

FORMULA:

Clorhidrato de alfa-dietilamino 2-6 acetoxilidida en vehículo acuoso.

INDICACIONES:

Anestesia local, regional, troncular y subaragnoidea.

CONTRAINDICACIONES:

No deberá aplicarse a pacientes hipertensos, sensibles.

REACCIONES SECUNDARIAS:

Cefalea, insomnio, palpitaciones.

DOSIS.

De 0.01 g. a 0.050 g, en casos especiales que el médico señale - se puede llegar a 0.75 g. 1 g. en una sola vez y por 24 horas..

VIA DE ADMINISTRACION:

Por infiltración

CITANEST (REGIONAL Y LOCAL)

Clorhidrato de prilocaina (sinónimos: propitocaina y 1-67)

ACCION E INDICACIONES: Citanest tiene el mismo corto período de latencia, la excelente profundidad, la buena difusión y la misma incidencia de anestesia satisfactoria que la de lidocaína y acción más prolongada y toxicidad 50 por ciento menos que ella. Ogrece así mayor seguridad y mayor eficacia y se considera hasta ahora el anestésico local de elección en bloqueos y en anestesia regional endovenosa.

ADMINISTRACION Y POSOLOGIA:

Para cartuchos: La dosis comunmente utilizada en de 1.8 ml.

CONTRAINDICACIONES:

En anestesia regional y por infiltración son contraindicaciones: sepsia de la región en donde se va a inyectar, choque severo - - bloqueo cardíaco. En anestesia peridural son contraindicaciones absolutas: sepsia de la región donde se va a inyectar, choque - severo y bloqueo cardíaco. Las contraindicaciones relativas son: Enfermedad neurológica presente, deformidades de la columna vertebral, septicemia, hipertensión e hipotensión severas y en personas hipersensibles a la prilocaina.

REACCIONES SECUNDARIAS:

En personas hipersensibles pueden presentarse náusea, cefalea, - vómito, taquicardia.

ANESTESICOS REGIONALES Y LOCALES PARA INFILTRACION

CARBOCAIN "I" Y "P"

CARBOCAIN "I". Solución isotónica estéril de clorhidrato de mepivacaína.

CARBOCAIN "P". Solución isobárica estéril de clorhidrato de mepivacaína.

ACCION E INDICACIONES: Más potente que la procaína y menos tóxica que la lidocaína, produce anestesia local rápida, profunda y prolongada.

CARBOCAIN I se usa en infiltración y bloqueo.

CARBOCAIN P en bloqueo caudal y peridural.

CONTRAINDICACIONES: Hipersensibilidad a las sales que contienen. REACCIONES SECUNDARIAS pueden presentarse, en raras ocasiones, - náusea, vómito.

Precauciones: Inyectar lentamente, usar dosis mínimas activa, - uso de agujas de longitud y bisel apropiado y evitar la inyección intravascular o intradural.

DOSES: Depende del método a seguir, región, respuesta del enfermo y técnica anestésica.

Por infiltración, hasta 40 ml al 1% (4) .

ANTIBIOTICOS.-

DEFINICION:

Etimológicamente antibiótico es lo que produce la destrucción de la vida, de manera que cualquier agente, físico ó químico capaz de matar será un antibiótico: desde luego no puede tomarse en cuenta dicho concepto.

Según WALISMAN: antibiótico es una sustancia química producida por microorganismo que tiene la capacidad de inhibir - el desarrollo e incluso de destruir bacterias y otros microorganismos.

CLASIFICACION.

GRUPO DE ANTIBIOTICOS.

PENICILINAS

Amoxicilina Trihidratada
Ampicilina
Ampicilina Trihidratada
Ampicilina Sódica
Bencil Peniciloil Polilisina Concentrada
Indanil Carbenicilina Sódica
Carbenicilina Disódica
Hetacilina
Nafcilina
Oxacilina
Penicilamina
Penicilina Aluminio
Penicilina Benzatina
Fenoximetil Penicilina Benzatina
Penicilina Cloroprocaina
Penicilina G Dibencilamina
Penicilina G Hidroyoduro Dietil Aminoester
Penicilina Efedrina
Penicilina G Hidrabamina
Fenoximetil Penicilina Hidrabamina
Fenoximetil Penicilina
Penicilina Procaína
Penicilina Sódica
Penicilina Cálcica
Penicilina Potásica
Penicilina Puffer
Feneticilina Potásica

Paramomicina
Sulfato de Estreptomina
Tobramicina

TETRACICLINAS:

Clorotetraciclina
Hicrato de Doxamiciclina
Doxiciclina Monohidratada
Clorhidrato de Metamiciclina
Clorhidrato de Minomiciclina
Oxitetraciclina
Oxitetraciclina Cálceica
Rolitetraciclina
Tetraciclina
Tetraciclina Fosfato complejo

PEPTIDOS:

Bacitracina
Bacitracina Zinc
Sulfato de Capreomicina
Colistimetalo Sódico
Sulfato de Colistin
Gramicidina
Sulfato de Polimixina B
Tirotricina
Sulfato de Viomicina

ANTIMICOTICOS:

Anfotericina
Candicidina

Griseofulvina

Nistatina

ANTITUMORALES:

Sulfato de Bleomicina

Dactinomicina

Mitramicina

Mitomicina

MACROLIDOS:

Eritromicina

Estolato de Eritromicina

Etilsuccinato de Eritromicina

Estearato de Eritromicina

Sulfato de Eritromicina

Troleandomicina

LINCOMICINAS:

Palmitato de Clindamicina

Fosfato de Clindamicina

Clorhidrato de Lincomicina Monohidratada

OTROS:

Anfomicina

Cloranfenicol

Palmitato de Cloranfenicol

Succinato sodico de Cloranfenicol

Cicleserina

Novobiocina Cálcica

Novobiocina Sódica

Clorhidrato de Vancomicina

Rifampina

" ESPECTROS. - "

ANTIBIOTICOS DE ESPECTRO
AMPLIO

Ampicilina
Cefalosporinas
Cloranfenicol
Rifamicina
Terazolidonas
Tetraciclinas

ESPECTRO INTERMEDIO

Aminocidina
Becanamicina
Cicloserina
Eritromicina
Virginiamicina
Estreptomina
Neomicinas
Gentamicina
Kanamicina
Paromomicina
Viomicina

ESPECTRO REDUCIDO

Bacitracina
Clindamicina
Colistin
Espectomicina
Espiramicina
Gramicidina
Leucomicina
Lincomicina
Novoviocina
Penicilinas
Polimixinas
Ristocetina
Tirotricina
Vancomicina

ANTIBIOTICOS DE LA CEFALOTINA:

Cefazolina Sódica
Cefacetil Sodico
Cefaloglicin Dihidratado
Cefaloridina
Cefalotina Sódica
Cefalexina Monohidratada
Cefapirina Sódica
Cefradina

OLIGOSACARIDOS:

Gentamicina
Estreptomina
Kanamicina
Neomicina
Dihidroestreptomina
Sulfato de gentamicina
Sulfato de kanamicina
Palmitato de Neomicina
Sulfato de Neomicina
Undecitenato de Neomicina

Antibióticos de espectro reducido.

PENICILINA: Cuando FLORE y colaboradores señalaron en 1941 los efectos notables de la penicilina, se dirigió inmediatamente la atención hacia la producción de este antibiótico en gran escala y a determinar su estructura, ambos problemas han sido resueltos. Hoy sabemos que la penicilina es uno de un grupo de compuestos - similares con espectro antibacteriano muy parecido pero diferente por la facilidad de producción y el grado de fijación a las - proteínas.

Otros problemas son el descubrimiento de formas inyectables que pueden tener ventajas sobre los compuestos naturales. Se está - trabajando intensamente con la esperanza de mejorar la absorción oral mediante determinadas manipulaciones químicas de la molécula de penicilina, y también con el objeto de modificar el espectro antibacteriano.

La penicilina es un ácido orgánico. Suelen emplearse sus sales de sodio, potasio, o con procaína.

Hay otras penicilinas naturales que difieren de la penicilina G por tener una cadena lateral que no es de bencilo. Algunos de - ellos son la penicilina F, la dihidro F ó Amilpenicilina y también las penicilinas K y X.

MODO DE ACCION:

La penicilina es bacteriostática y bactericida. Inclusive en concentraciones muy bajas de penicilina, la bacteria sensible no puede multiplicarse. En tal caso puede adquirir características morfológicas anormales y sufrir lisis.

La actividad bactericida de la penicilina es muy diferente a

la que tienen los desinfectantes comunes.

La penicilina no mata las bacterias rápidamente por contacto. Parece producir alguna alteración de la bacteria, que la hace más susceptible de muerte y destrucción. Se ha comprobado que las bacterias en rápida multiplicación son más sensibles al efecto bactericida de la penicilina.

Las bacterias sensibles fijan al antibiótico cosa que no hacen las células de los mamíferos. Los extractos de células de bacterianos desintegrados también pueden fijar penicilinas.

PREPARADOS.

Numerosos preparados de penicilina G para toda vía de administración se ofrece al médico bajo una confusa diversidad de nombres comerciales.

Existen tres tipos principales de penicilinas G.

PENICILINA G en solución acuosa para uso parenteral.

Las dos que tienen carácter oficial son:

PENICILINA G POTASICA estéril

PENICILINA G POTASICA amortiguada para inyección

Los preparados son polvos cristalinos envasados para uso parenteral en forma seca estéril en frasquillos que contienen de 1,000,000 a 5,000,000 de unidades.

PREPARADOS DE PENICILINA G. Para uso parenteral en forma de depósito para acción prolongada.

La penicilina de depósito nunca debe de inyectarse por vía intravenosa, ni subcutánea, ni en cavidades del cuerpo.

Suspensión de penicilina G procaínica estéril U.S.P. es un preparado de la sal cristalizada se suspenden al 0.04% en agua.

Suspensión de penicilina G procaínica estéril con monoeste-
rato de aluminio.

Los preparados de penicilina procaínica se presenta en car-
tuchos de 5 ml. y en frascos ampula con 300,000 unidades del --
antibiótico.

Suspensión de penicilina G benzatínica U.S.P.

Se presenta para inyección intramuscular en frasco ampula
que contiene 600,000 U.

PENICILINA G POTASICA, PENICILINA G SODICA.

Se presentan en comprimidos de 50,000 a 500,000 unidades -
ESTREPTOMICINA.

La estreptomicina descubierta en 1944 difiere de la penici-
lina por ser una base orgánica y no un ácido. No es absorbida
por el tubo digestivo, tiene un espectro antibacteriano mucho -
más amplio, aunque generalmente de menor potencia y posee acción
directa tóxica en el mamífero.

La estreptomicina es mucho más eficaz para las infecciones
urinarias y la tuberculosis pero estas dos enfermedades tanto la
bacteria como el bacilo pueden presentar resistencia a la estrep-
tromicina.

PREPARADOS.

SULFATO DE ESTREPTOMICINA

La estreptomicina no se absorbe en grado notable administran-
dolo oralmente, suele inyectarse por vía intramuscular con inter-
valos de 6 a 12 horas y dosis de 1 a 2 g. por día.

NEOMICINA

La neomicina es otro antibiótico nefrotóxico muy útil para -

quimioterapia intestinal y aplicación tópica.

El sulfato de neomicina es un poderoso antiséptico intestinal y se encuentra en el comercio en tabletas de 0.5 g. pueden administrarse varios gramos antes de una intervención quirúrgica intestinal, ya que el producto se absorbe muy poco por vía digestiva.

KANAMICINA.

Junto con la neomicina pertenece al grupo de la estreptomina difiere de ésta por el desarrollo más lento de resistencia en las bacterias, puede causar lesión auditiva, a pesar de este inconveniente, y en la necesidad de administrarla por vía intramuscular la kanamicina es muy útil en infecciones causadas por gérmenes gram negativos como proteus que puede ser resistente a todos los demás antibióticos.

La kanamicina se administra por vía intramuscular en dosis de 0.5 g cada 6 horas el producto resulta muy tóxico cuando el riñón no funciona normal.

ANTIBIOTICOS DE ESPECTRO AMPLIO

TETRACICLINAS:

Los 3 antibióticos tetraciclínicos, clorotetraciclina (aureomicina), oxitetraciclina (terramicina) y tetraciclina, fueron descubiertos después de amplios estudios de selección de antibióticos producidos por gérmenes del suelo.

Estas drogas se caracterizan por un espectro antibacteriano amplio, eficaces administradas por vía oral, e índice terapéutico muy favorable, esencialmente son productos bacteriostáticos excepto en concentraciones muy elevadas. Su empleo en muchos casos modifica la infección en vez de suprimirla completamente.

PREPARADOS:

Están disponibles en el comercio en diversas formas para administración oral y parenteral.

Las tetraciclinas se prescriben por lo general por vía oral pero también para inyección intramuscular e intravenosa.

Todas las tetraciclinas antes mencionadas se encuentran disponibles para administración oral. Por lo general en cápsulas, a veces en forma de tabletas, en dosis de 50 a 250 mg.

Preparados por vía parenteral.

Se administran en frascos ampola que contienen 100, 250 ó 500 mg. de sal cristalina desecada, mezclada con un amortiguador.

CLORANFENICOL:

El cloranfenicol es un antibiótico de amplio espectro que posee espectro y potencia muy similares a los de la tetraciclina, sin embargo no es eficaz contra *Entamoeba histolytica*, pero lo es más que las tetraciclinas en el tratamiento de la fiebre tifoidea.

El cloranfenicol ha sido ampliamente utilizado, prácticamente con las mismas indicaciones clínicas de las tetraciclinas. Se reconoció que su empleo en algunos casos se acompañan del desarrollo de discrasias sanguíneas como anemias aplásticas y agranulocitopenia.

El producto es bien absorbido por el tubo digestivo. Es metabolizado en gran parte, de manera que sólo el 10 por ciento de la dosis administrada aparece en la orina sin modificación.

El cloranfenicol quizá sea el mejor antibiótico para tratar la tifoidea, también es muy eficaz prácticamente con las mismas -

indicaciones que la tetraciclinas, pero estas últimas se prefieren a consecuencia de la acción del cloranfenicol sobre la médula ósea, en infecciones graves por gérmenes resistentes puede tener que emplear cloranfenicol si las pruebas de sensibilidad lo justifican. Se administra diariamente en cápsulas de 250 mg. la dosis del adulto es de 4 a 8 cápsulas cada 24 horas. Las cápsulas para administración oral se expenden en 50, 100 y 250 mg. cada una.

ERITROMICINA:

La eritromicina fué aislada de la cepa de STREPTOMYCES. Es una base orgánica con un peso molecular de 700 aproximadamente. Este antibiótico es particularmente eficaz contra microorganismos gram positivos, aunque también son afectados los gonococos, los gérmenes Haemophilus y los grandes virus del grupo del linfogranuloma venéreo. Su espectro antibacteriano queda entre la penicilina y de las tetraciclinas, pero no son inhibidos los bacilos gram negativos como Escherichia coli y Salmonella. Su modo de acción parece ser bacteriostático, ya que solo es bactericida en concentraciones muy elevadas.

El jugo gástrico tiende a destruir la eritromicina pero los preparados con revestimiento entérico y el estearato de eritromicina son bien absorbidos.

Se administra en dosis de 0.5 g cada 6 horas y pueden obtenerse concentraciones sanguíneas de 2µg/ml o mayores, muchos gérmenes gram positivos son inhibidos por concentraciones inferiores a ésta.

La eritromicina se considera un sustituto de la penicilina -

en los casos en los que hay dificultades para utilizar esta ó se han producido microorganismos resistentes.

LINCOMICINA:

La lincomicina antibiótico recientemente introducido, parece no tener relación estructural con ningún quimioterápico conocido. Sin embargo, sus efectos sobre las bacterias se parecen a la de los antibióticos macrólidos como la eritromicina. El producto es eficaz contra estafilococos, estreptococos y neumococos. Como las penicilinas suelen ser los agentes de elección contra - estos dos últimos gérmenes, la lincomicina quizá sólo sea otra - adición a los agentes disponibles para infecciones estafilococci cas. La lincomicina se administra por vía oral aunque puede - - darse por vía intramuscular o intravenosa en dosis de 500 mg., 3 veces al día. Como excepción de las molestias gastrointestinales, no es probable que aparezcan efectos secundarios graves.

RIFAMPINA:

Es un derivado de la rifamicina "B" natural aislada de *Streptomyces mediterranei*. Su espectro antibacteriano incluye la mayor parte de casos gram positivo y gram negativo, diversos bacilos gram negativos y *Mycobacterium tuberculosis*. Está comprobada su eficacia terapéutica en el tratamiento de la tuberculosis y la eliminación de portadores de meningococos.

La rifampina inhibe la polimerasa de RNA dependiente de DNA. Después de administración oral de 600 mg., de rifampina se alcanzan concentraciones sanguíneas de 8 mg/ml en menos de 2 horas.

SULFAMIDAS:

La mayor parte de las sulfamidas útiles en clínica pueden con

siderarse derivadas de la sulfanilamida. Por lo regular, solo aquellos sulfamídicos que tienen un grupo paraamino presentan actividad antibacteriana. Los compuestos substituidos en el grupo amínico sólo son activos si el substituyente es eliminado por el cuerpo.

Las substituciones en el grupo amida han producido algunas de las sulfamidas más importantes, y las ventajas sobre la sulfanilamida estriban en mayor potencia, espectros antibacterianos más amplios e índice terapéutico mayor.

Las sulfamidas sustituidas en el grupo amínico pueden ser útiles como antisépticos intestinales si el substituyente se suprime poco a poco en el intestino y el compuesto no es absorbido en grado importante.

Con ejemplos el Succinilsulfatiazol y el Italilsulfatiazol. Cuando se introdujo la sulfadiacina en terapéutica, pronto se comprobó que era superior a los sulfamídicos utilizados hasta entonces como sulfapirina y sulfatiazol.

La superioridad se manifestaba particularmente por menos toxicidad que la sulfapirina y menos efecto sensibilizante que el sulfatiazol. Sin embargo, la sulfadiacina tenía dos inconvenientes: debía administrarse repetidamente para conservar una concentración terapéutica en el cuerpo, o era poco soluble en la concentración urinaria usual del ion-hidrógeno su producto de biotransformación, acetilsulfadiazina, todavía era menos soluble. En consecuencia, existía siempre el peligro de cristaluria.

Los nuevos sulfamídicos, como el sulfisoxazol resultan mucho más solubles en el pH urinario usual. Otro fin perseguido al sin-

tetizar una nueva sulfamida ha sido la prolongación de la semi-desintegración del medicamento en el cuerpo, disminuyendo la necesidad de administración frecuente.

Este objetivo ha sido logrado con sulfamídicos como la sulfametoxipiridacina, la Sulfadimetoxina que es el Sulfafenasol.

SULFAMIDAS MAS IMPORTANTES PARA VIA GENERAL.

SULFATIAZOL

SULFADIAZINA

SULFAMERAZINA

SULFAMETAZINA

SULFASOMIDINA

SULFACETAMIDA

SULFISOXASOLE

SULFAMETIZOL

SULFAMETOXIPIRIDAZINA

SULFAGUANIDINA

SUCCINILSULFATIAZOL

FTALILSULFATIAZOL

COMPARACION DE OTROS SULFAMIDICOS CON LA SULFADIAZINA Y DOSIS

Las primeras sulfamidas, sulfapiridina y sulfatiazol, han sido prácticamente eliminadas en clínica por su mayor toxicidad y por la producción mucho más frecuente de reacciones de hipersensibilidad.

La sulfameracina y la sulfametacina se parecen a la sulfadiazina en varios aspectos, excepto por el hecho de ser eliminadas más lentamente por el riñón y unirse a las proteínas plasmáticas en producción mucho mayor. La principal utilidad de estas sulfadiazinas metiladas es su inclusión en las mezclas de sulfamidas triples.

Desde que se comprobó que la baja solubilidad de la sulfadiazina y acetilsulfadiazina en la orina ácida resulta un grave inconveniente, se han hecho muchos intentos para impedir la precipitación de sulfamidas en la orina. La alcalinización y la ingestión de mucho líquido para mantener el volumen urinario adecuado son útiles, pero no suelen resolver el problema. Como las diversas sulfamidas pueden estar en solución juntas sin que las respectivas solubilidades se modifiquen, se han propuesto emplear muestras de tres o más de estos productos que permitan conservar concentraciones sanguíneas más elevadas y concentraciones urinarias más elevadas de sulfamídico total sin el peligro de cristaluria.

La dosis usual de mezcla de sulfamida triple es de dos a cuatro gramos inicialmente, seguida de 1g cada 6 horas en el adulto. Los niños reciben 60 a 100 mg/kg., inicialmente, seguidos de la cuarta parte de esta dosis cada 6 horas.

El sulfisoxazol tiene propiedades antibacterianas similares a las de la sulfadiazina. Su solubilidad a pH 6 es mucho mayor que la de la sulfadiazina; de hecho, es 10 veces más soluble. A pH 5.5 su solubilidad en la orina humana es de aproximadamente - 120 mg/100ml, lo cual todavía es cuatro veces mayor que la solubilidad de la sulfadiazina, pero no constituye una garantía contra la formación de cristales. El sulfisoxazol es eliminado rápidamente de la sangre y produce valores urinarios altos.

Los sulfamídicos que se han introducido en terapéutica guardan relación con la introducción de productos que tienen una - - eliminación renal muy baja, para lograr concentraciones sanguíneas constantes basta emplear dosis relativamente pequeñas y administraciones menos frecuentes. La sulfametoxipiridacina se elimina tan lentamente que 24 horas después de administrar 1 g. de - éste producto todavía persisten concentraciones sanguíneas de - 5 a 10 mg/100 ml. En consecuencia, basta una dosis inicial de - 2 g, seguida de 1 g una vez al día para conservar valores terapéuticos en la sangre.

Otro medicamento del grupo de las sulfamidas que tienen una eliminación renal lenta es la sulfadimetoxina.

Las sulfamidas eliminadas lentamente, como la sulfametoxipiridacina y la sulfadimetoxina se han relacionado con el desarrollo de un síndrome grave, incluso mortal, de STEVENS-JOHNSON (Eritema exudativo multiforme).

Por este motivo se prefieren las sulfamidas de acción breve.
SULFAMIDAS COMO ANTISEPTICO INTESTINALES.

Las sulfamidas que se absorben poco a nivel del intestino - pueden utilizarse para disminuir la flora bacteriana intestinal.

La sulfaguanidina fué el primer sulfamédico introducido con este fin. Sin embargo, la tercera parte aproximadamente de la dosis administrada es absorbida. En consecuencia, pronto fué substituida con este fin especial por productos de absorción mucho menor.

El succinilsulfatiazol (Sulfasuxidine) y el Ftalilsulfatiazol (Sulfathalidine) tienen sustituida la porción paramino de la molécula del sulfatiazol. En consecuencia, carece de actividad antibacteriana en el tubo de ensayo. Sin embargo cuando son ingeridos y llegan al intestino grueso son hidrolizados y el sulfatiazol libre alcanza localmente concentraciones elevadas. Al mismo tiempo, este sulfatiazol se absorbe poco por el intestino grueso. Ambos productos se administran en dosis elevadas antes de operaciones en el intestino, y para tratamiento de algunas infecciones intestinales. No se absorbe más del 3 al 5 por ciento de la dosis administrada y las reacciones adversas son raras.

La dosis usual de estos productos para el adulto son de 0.125 a 1.5 g/kg.

MEDICAMENTOS ANTICOAGULANTES

La farmacología de la coagulación sanguínea y de la hemostasia se refiere principalmente a la modificación de los dos procesos fisiopatológicos fundamentales estudiados y comprende:

Agentes Anticoagulantes: Que impiden o retardan la coagulación sanguínea y que se utilizan en la trombosis.

Agentes Coagulantes Hemostáticos: Que favorecen la coagulación sanguínea y que son empleados en las hemorragias.

Además de estos dos grupos de drogas, existen los agentes fibrinolíticos que no actúan modificando el proceso de la coagulación sanguínea, sino disolviendo el coágulo fibrinoso una vez formado. (1, 5, 6 7).

CLASIFICACION

Los Anticoagulantes que actúan "IN VITRO" son esencialmente sustancias descalcificantes.

Los fármacos utilizados con más frecuencia son:

OXALATO DE POTASIO

CITRATO DE SODIO

Los anticoagulantes que actúan "IN VIVO" son aquellos que provocan, pues, un descenso del nivel de protombina en el plasma. Esto se puede alcanzar por medio de los fármacos como son:

BISHIDROXICUMARINAS

FENILINDANDIONA

INDANDIONAS

DIFENANDIONA

CUMARINA

AMISINDIONA

WARFARINA

Heparina que inhibe la coagulación de la sangre "IN VITRO"

e "in vivo". Su acción más importante es como factor antitrombina; algunas de sus otras acciones probablemente sean consecuencia de ésta. El efecto antitrombina requiere la presencia de un cofactor plasmático, no bloquea la interacción de trombina purificada y fibrinógeno en el tubo de ensayo.

Además de este efecto sobre la trombina, la heparina inhibe la conversión de protombina en trombina y tiene un efecto tromboplástico. Es posible que ambas acciones sean consecuencia de una acción antitrombina primaria.

PREPARADOS:

La Bishidroxycumarina, existe en tabletas y cápsulas en dosis de 25, 50, 100, 200 mg. La dosificación que se recomienda es de 300 mg. el primer día, 200 mg. el segundo día y una dosis media de mantenimiento de 75 mg. al día.

La Warfarina Sódica, se presenta en comprimidos que comprenden 2.0, 2.5, 5.0, 7.5, 10 y 25 mg. por comprimido.

La dosis inicial de 40 a 60 mg. seguida de una dosis diaria de mantenimiento de 2 a 15 mg.

Existe como solución inyectable de heparina sódica en solución que contiene 1,000, 5,000, 10,000, 20,000, 40,000, unidades por mililitro en vehículos de dextrosa y gelatina con el fin de hacer lenta la absorción.

Por goteo continuo, se añade 20,000 a 30,000 unidades de heparina, a un litro de solución glucosada al 5% de cloruro de sodio al 0.9% solución que se administra al paciente en 24 horas.

Coagulantes locales hemostáticos:

La hemostasia constituye muchas veces un problema exclusivamente mecánico y se realiza en el caso de lesiones de vasos accesibles mediante una ligadura ó sutura de tejido, que lo engloban y comprimen, en las hemorragias de vasos pequeños, la compresión sostenida hasta la formación del coágulo es una medida adecuada.

Desde el punto de vista farmacológico las sustancias -- utilizadas para provocar la coagulación sanguínea y la hemostasia "IN SITU" corresponden a algunos elementos naturales de la coagulación como la TROMBOPLASTINA, TROMBINA, FIBRINA.

También hay otros como la Vitamina "K"

PREPARADOS:

FITONADIONA (Vitamina K₁): Es un líquido viscoso, insoluble en agua, se presenta en comprimidos de 5 mg. cada uno y en ampollitas que contienen emulsión de 5mg./ml. de fitonadiona -- 0.25 mg. se dispersa en una solución amortiguada de polisorbato y propilenoalcohol o de derivados polietilados de ácidos grasos y dextrona, se administra por vía intramuscular.

PERANADIONA, es un polvo blanco, cristalino, higroscópico, muy soluble en agua y se presenta en comprimidos de 5 mg. en ampollitas que contienen 5 a 10 mg./ml.

FIBRINOLISINA: La sangre tiene la capacidad de disolver los coágulos por medio del sistema fibrinolítico. Hay motivos para creer que este sistema funciona en circunstancias normales para suprimir depósitos menores de fibrina que se producen

en los pequeños vasos.

La fibrinolisisina, llamada también plasmina por algunos investigadores, es una enzima proteolítica que ataca diversas proteínas, pero tiene gran afinidad por el fibrinógeno o la fibrina.

El plasminógeno o profibrinolisisina, se encuentra en el plasma como precursor inactivo de la fibrinolisisina. Entre las sustancias que pueden activarlo directa o indirectamente en el hombre se haya la estreptocinasa.

La estreptocinasa se presenta comercialmente en combinación con estreptodornasa, enzima que puede despolimerizar los ácidos nucleicos. La principal aplicación de este tipo de preparados ha sido un empleo para disolver exudados inflamatorios purulentos que contienen fibrina, como en el hemotórax y el empiema.

El preparado usual de estreptocinasa con estreptodornasa (Varidasa) contiene 100,000 unidades de la primera y 25,000, unidades de la segunda. Las dosis varían ampliamente según la cantidad de material que debe disolverse. Pueden presentarse efectos secundarios después de administrar estos activadores (1, 5, 6, 7), es muy frecuente una respuesta febril pocas horas después de administrar varidasa.

Son posibles otras reacciones localizadas o generalizadas, y sospechas de reacción alérgica. El preparado es antigénico, y su eficacia tiende a disminuir con la administración prolongada, probablemente por el desarrollo de anticuerpos contra él.

HEPARINA

FORMULA: Cada ml. contiene:	HEPARINA	HEPARINA
HEPARINA SODICA	1,000 U.I.	10,000 U.I.

ACCION:

La heparina actúa como anticoagulante, inhibiendo principalmente la formación de trombina y secundariamente de protrombina.

INDICACIONES Y POSOLOGIA: La Heparina puede usarse para el tratamiento y profilaxis de la fiebrilis y tromboflebitis, trombosis o embolismo, infarto pulmonar y del miocardio y en cirugía cardiovascular. Se emplea también como auxiliar en el tratamiento de arteriosclerosis y en otros padecimientos que cursan con hiperlipidemia. En el laboratorio se usa como anticoagulante en los frascos o bolsas para recolección de sangre.

ADMINISTRACION Y POSOLOGIA: Heparina puede ser administrada por diferentes métodos.

Inyección intravenosa continua.- 20,000 unidades deberá ser disuelta en 1,000 ml. de solución isotónica de cloruro de sodio. La velocidad de goteo debe ajustarse entre 15 y 20 gotas por minuto de manera que en 24 horas se administre un total de 2,000 ml. (40,000 unidades de heparina).

Inyección intravenosa intermitente.- De 5,000 a 10,000 unidades de heparina se administran cada 4 o 6 horas. De 0.5 a 1 ml. de heparina de 10,000 se aplica sin diluir o diluidos en 50 o 10 ml. de solución isotónica de cloruro de sodio.

Inyección intramuscular o subcutánea profunda.- Para la terapéutica anticoagulante prolongada la acción terapéutica de la heparina puede prolongarse inyectando por vía intramuscular o subcu -

tánea profunda 10,000 unidades de heparina.

No debe darse masaje en el sitio de la inyección.

En caso de que se necesite contrarrestar de inmediato el efecto de la heparina, debe suministrarse por vía intramuscular de solución de Protamina al 1%.

CONTRAINDICACIONES: En enfermos con insuficiencia hepática - grave, con alteraciones de la coagulación o en caso de púrpura.

REACCIONES SECUNDARIAS: Pueden presentarse epistaxis, petequias, sangrado de encías y en otros sitios.

PRESENTACION:

HEPARINA 1,000 UI/ml: Frasco ampula 10 ml.

HEPARINA 5,000 UI/ml: Frasco ampula 5 ml.

HEPARINA 10,000 UI/ml: Frasco ampula 5 ml.

TRASYLOL Inactivador de la Kalicreina

FORMULA: Cada ampolleta de 10 ml. contiene:

Inactivador de kalicreina - Tripsina, 100,000 unidades inactivadoras de kalicreina.

INDICACIONES: Para disminuir la proteolisis aumentada y acelerada después de traumatismo, hemorragias por fibrinólisis, fibrinopenia, afibrinogenemia, transfusiones con sangre conservada, intervenciones quirúrgicas grandes, infecciones generalizadas graves, quemaduras graves, extensas, que originan autointoxicación peritonitis, estado de shock.

Para inhibir fermentos proteolíticos activados por mecanismos patológicos en: Pancreatitis aguda; necrosis hemorrágica del páncreas. Protección operatoria para el páncreas y para otros órganos circunvecinos al páncreas.

CONTRAINDICACIONES: Reacciones alérgicas contra el preparado.

REACCIONES SECUNDARIAS: Por su estructura de polipéptido cabe suponer reacciones secundarias de tipo alérgico, urticaria, -- prurito.

PRESENTACION: Caja con ampula de 10 ml. con 100,000 U.I.K. cada una. (4)

LIQUEMINF

Anticoagulante

Heparina pura, desprovista de elementos extraños

INDICACIONES: Anticoagulante, fibrinolítico, trombosis, embolia infarto de miocardio.

CONTRAINDICACIONES: Tiempo de coagulación aumentado, discrasias sanguíneas, tromboflebitis supurada, hemorragia cerebral activa.

REACCIONES SECUNDARIAS: Manifestaciones alérgicas, escalofríos, epistaxis, petequias, sangrado de encías en casos de sobredosificación.

DOSIFICACION: Trombosis, profilaxis: 25,000 a 40,000 U.I. en 24 horas durante 6 y 8 días, repartidos en 4 inyecciones.

TERAPEUTICA (Casos moderados) 40,000 a 60,000 U.I. en 24 horas en 4 inyecciones I.V. (**CASOS GRAVES**): 60,000 a 80,000 U.I. en 24 horas en 4 inyecciones I.V. incluso hasta 120,000 U.I. en casos sumamente grave, eventualmente repartidos en 5 a 6 inyecciones.

ACCION ANTLIPEMICA: Angor, hipertensión, ateromatosis: 2,500 a 5,000 U.I. I.V., 2 a 3 veces por semana.

ANTAGONISTA: Sulfato de protamina en inyecciones I.V.,

PRESENTACION: Caja con un frasco ampula con 5 ml. conteniendo 5,000 U.I., por ml.

SULFATO DE PROTAMINA: Caja con una ampolleta con 5 ml. conteniendo 50 mg.

Los medicamentos anticoagulantes orales actualmente en uso son:

Derivados de la cumarina

Derivados de la Inandiona

BISHIDROXICUMARINA

FENILINDIOLINA

FENPROCUMONA

DIFENILINDIOLINA

WARFARINA

ANISINDIOLINA

ACENOCUMAROL

INTERACCION DE ALGUNOS ANTICOAGULANTES ORALES CON AGENTES ANALGESICOS Y ANTINFLAMATORIOS:

EFFECTOS

CONDUCTA RECOMENDADA.

SALICILATOS

Aumenta la actividad anticoagulante por - que disminuye la protombina plasmática.

Evitar que los pacientes que reciben anticoagulantes orales ingieran salicilatos.

Desplazan al anticoagulante de los sitios de unión a las protéinas plasmáticas.

el acetaminofen una alternativa aceptable.

Aumenta el riesgo de ulceración y sangrado gástrico.

INDOMETACINA

Posiblemente hay cierto desplazamiento de los anticoagulantes de los sitios de unión de las proteínas plasmáticas.

Evítese el uso de indometacina con pacientes que reciben anticoagulantes orales.

EFFECTOS

Es posible un ligero aumento de la relación hipotrombinémica a los anticoagulantes orales.

ACETAMINOFENO

CONDUCTA RECOMENDADA

El acetaminofeno es una alternativa al uso de salicilatos a los pacientes que se les administran anticoagulantes orales. No debe usarse en los pacientes que a veces muestran aumento del efecto anticoagulante por su uso.

INTERACCION DE ALGUNOS ANTICOAGULANTES CON SEDANTES HIPNOTICOS.

Disminuye la respuesta anticoagulante debido a que disminuye su absorción digestiva y favorecen la actividad de las enzimas hepáticas que metabolizan éstos.

BARBITUPICOS

No se administren barbitúricos a los pacientes que reciben anticoagulantes orales. De no ser posible no se suspenda el barbitúrico ni se cambie la dosis sin revalorar simultáneamente la dosis del anticoagulante.

CLUTETIMICA

Disminuye la acción de los anticoagulantes.

ETILCLOROVINOL.

Por la actividad de las enzimas hepáticas que los metabolizan.

Igual para los anticoagulantes.

INTERACCIONES DE ALGUNOS ANTICOAGULANTES CON ANTIMICROBIANOS.

EFFECTOS

Aumenta la actividad anti-coagulante porque disminuye la vitamina k del intestino e inhibe el metabolismo de algunos anticoagulantes orales.

CLORANFENICOL

Aumenta la actividad anti-coagulante por un mecanismo todavía desconocido.

TETRACICLINAS

AMINOGLUCOSIDOS.

NEOMICINA

Aumenta la actividad

GENTAMICINA

anticoagulante debido

KANAMICINA

a que disminuyen los

ESTREPTOMICINA

niveles de vitamina en

TOBRAMICINA

el intestino.

Aumentan la actividad

CEFALOTINA

anticoagulante debido

CEFALORIDINA

a que disminuyen los

CEFALOSPORINAS

niveles de vitamina k en

CEFAPIRINA

el intestino.

CONDUCTA RECOMENDADA

Siempre que sea posible, evítase el uso del cloranfenicol, si éste no es necesario, si fuera posible, vigile cuidadosamente los efectos anticoagulantes.

No son importantes las interacciones con las tetraciclinas. Evítase el uso prolongado de estos antibióticos por la vía oral en pacientes que reciben anticoagulantes orales.

Esta interacción es más importante con los aminoglucósidos orales.

Esta interacción es más importante con las cefalosporinas orales. El riesgo es mayor conforme aumenta la dosis del antibiótico.
(1, 2, 12, 13, 17)

MEDICAMENTOS ANTIINFLAMATORIOS:

Proceso inflamatorio.

La inflamación incluye los cambios tisulares que se produce en la respuesta a un insulto.

Cuando ocurre lesión en los tejidos, causada por bacterias, traumatismo, productos químicos, calor o cualquier otro fenómeno, las células lesionadas liberan una sustancia denominada - - "Necrosina" que pasa a los líquidos vecinos. Esta sustancia - destruye algunas de las células adyacentes, pero también aumenta la permeabilidad de los capilares vecinos permitiendo que escape hacia los tejidos, grandes cantidades de líquidos o proteínas - incluyendo fibrinógeno. El resultado es un edema extracelular - local, el líquido extracelular y el líquido linfático se coagula por efecto de la necrosina sobre el fibrinógeno que escapó de la sangre. Así se desarrolla un edema duro en los espacios que - rodean las células lesionadas (5, 6, 7).

SALICILATOS.

ACIDO SALICILICO: Es un compuesto orgánico simple que ejerce - notables efectos analgésicos, antipiréticos, antiinflamatorios, antirreumáticos, en el hombre.

Los diversos preparados relacionado con el ácido salicilico se denominan, en conjunto salicilatos. Los más frecuentemente - utilizados son el Salicilato sódico, el Acido Acetil Salicilico y más recientemente la Salidamina.

EFFECTOS ANTIINFLAMATORIOS DE LOS SALICILATOS.

En la fiebre reumática la administración de grandes dosis - de salicilatos disminuye la fiebre, alivia las molestias articula

res, y normaliza la velocidad de sedimentación aumentada.

El efecto antirreumático de los salicilatos probablemente sea sólo manifestación de su acción antiinflamatoria. Esta última acción puede demostrarse experimentalmente en estudio de inflamación provocada inyectando irritantes como la carragenina, una poligalactosa sulfatada.

La potencia antiinflamatoria de una serie de drogas guarda buena correlación con su utilidad como antirreumáticos en el hombre.

En odontología se usan

Los dos preparados de salicilatos para efectos orales son el salicilato de sodio y la aspirina (ácido acético salicílico). Se expenden en tabletas que contienen 0.3 ó 0.6 del principio activo. LA ASPIRINA. U.S.P., es un polvo cristalino, poco soluble en el agua. Se expende en tabletas de 0.15, 0.3 y 0.6 g. cápsula 0.15 y 0.3 g supositorios 0.125, 0.3, 0.6 g.

NOTA:

La aspirina como tal (U.S.P.) no se administra sola sino principalmente en forma de tabletas.

Analgésicos no salicílicos.

Aminopirina:

Se utilizaron mucho en un tiempo como analgésicos y antipiréticos. Los analgésicos no salicílicos se han abandonado casi totalmente por que los salicilatos ejercen prácticamente la misma acción beneficiosa sin producir sensibilización notable. En la actualidad solo se utiliza para medir el volumen de agua corporal total.

Aunque la aminopirina es antipirética, analgésica, antirreumática eficaz ha causado agranulocitosis en un número importante de pacientes. En consecuencia y dada la mayor seguridad de otros analgésicos, no hay motivo para prescribir la aminopirina.

DIPIRONA:

El medicamento muy similar también es peligroso por su capacidad de causar agranulocitosis. El medicamento goza de gran popularidad en algunos lugares porque es uno de los pocos analgésicos no narcóticos inyectable. Sin embargo es dudoso lo que ocurra con un empleo continuado, ya que la droga ha causado varias muertes.

FENILBUTAZONAS:

Acciones Farmacológicas: Esta droga es particularmente - - eficaz para tratar la artritis reumatoide, osteoartritis y gota. - Su eficacia se haya aproximadamente entre la de los salicilatos y la de los esteroides antiinflamatorios.

La dosis es de 200 mg. al día pero se puede aumentar hasta 600 mg al día.

NUEVAS DROGAS ANTIINFLAMATORIAS.

LA INDOMETACINA.

Es muy eficaz en la artritis. Sin embargo, puede, producir úlcera péptica, cefalea, trastornos hematológicos y otros efectos secundarios, que quizá limiten su utilidad. Se administra - oralmente en dosis de 25 mg. dos o tres veces al día.

Acido Flufenámico:

Es otro medicamento antiinflamatorio nuevo y potente. Toda vía no conocemos cuál sea su verdadero lugar en terapéutica. Se utilizan dosis de 300 mg. por vía oral. El ácido mefenámico muy

similar, no parece tener ventaja sobre la aspirina.

AFLAMINA Antiinflamatorio, analgésico y antipirético.

FORMULA: Cada cápsula contiene:

1, 2-difenil- 3, 5-dioxo -4-n butil - pirazolidin-hexahidropi-
razina 300 mg.

Cada supositorio para adulto contiene:

1,2 difenil - 3, 5 dioxo -4-n butil pirazolidin-hexahidropi -
razina 425 mg.

Cada supositorio para niños contiene:

1, 2-difenil-2,5 dioxo -4-n-butyl - pirazolidin-hexahidro -
pirazina 125 mg.

CARACTERISTICAS: Aflamina desarrolla su potente acción antiin-
flamatoria, analgésica y antipirética, en los procesos inflama-
torios de cualquier origen.

En los cuadros infecciosos, Aflamina favorece la actividad del
antibiótico y de las defensas orgánicas, al reducir el proceso
exudativo inflamatorio.

Su tolerancia gástrica es excelente aún en tratamientos prolon-
gados. No provoca retención de líquidos y si en cambio posee
discreta acción diurética.

INDICACIONES:

Procesos inflamatorios: Post-traumáticos, post-quirúrgicos, in-
fecciones, ginecológicos, vasculares.

Procesos reumáticos: Reumatismo muscular, artritis reumatoide, -
artrosis en fase dolorosa, ciática, torticolis y lumbago.

DOSIS:

Adulto: 1-2 cápsulas, 3 veces al día, preferentemente después de

Los alimentos, o un supositorio 3 veces al día.

Niños: Un supositorio 3 veces al día.

PRESENTACIONES:

Frasco con 20 o 50 cápsulas.

Caja con 5 supositorios para adulto.

Caja con 5 supositorios para niño.

REACCIONES SECUNDARIAS: Por la vía oral en casos aislados pueden presentarse náuseas o molestias abdominales.

CONTRAINDICACIONES: Como medida de precaución, se recomienda prescindir de la vía oral en los pacientes con úlcera gastroduodenal.

ANANASE F

FORMULA: Cada gragea con capa entérica contiene:

Bromelina (Proteasas de Ananas comosus) 40 mg.
(100,000 U.)

Excipiente C.B. 415 mg.

INDICACIONES: Ananase F tiene acción antiinflamatoria producida por la acción fibrinolítica triple y la acción obradiorinica de las bromelinas. La cantidad doble de bromelinas que contiene por gragea, simplifica la administración y proporciona mejores resultados terapéuticos.

Es útil en procesos inflamatorios de cualquier etiología como: Traumatismo, infecciones, trastornos vasculares, post-operatorio.

CONTRAINDICACIONES: Trastornos de la coagulación sanguínea, insuficiencia hepática o renal, insuficiencia cardíaca congestiva, pancreatitis aguda.

REACCIONES SECUNDARIAS: A dosis elevadas y por tiempo prolongado

puede ocasionar trastornos de la coagulación sanguínea: náuseas, vómito, gastritis, hematuria y erupción de la piel.

DOSIS: Una gragea 2 veces al día.

PRESENTACION: Frasco con 16 grageas con capa entérica. (4)

BARBITURICOS

Barbitúricos de acción breve: secobarbital (Seconal)

Pento barbital. (Nembutal)

De acción intermedia: amobarbital (Amital)

De acción prolongada: fenobarbital (Luminal)

Combinaciones: secobarbital + amorbital (Tuinal)

DEPENDENCIA FISICA Y TOLERANCIA

Se produce intensa dependencia física y tolerancia para todos los barbitúricos. Hay un límite superior neto para la tolerancia, de manera que un ligero aumento de dosis puede de de desencadenar síntomas tóxicos (5).

CARACTERISTICAS DEL ABUSO

Los efectos de dosis ordinarias de barbitúricos incluyen sedación (sin analgesia), disminución de la agudeza men tal, palabra lenta y labilidad emocional.

Los síntomas tóxicos resultantes de una dosis excesiva, incluyen ataxia, diplopía, nistagmo, vértigo, y signo de Ro-- berg positivo. Hay peligro de dosis excesiva por comenzar -- tardíamente el efecto de los barbitúricos de acción prolongada y también como resultado de la deformación de la percep- - ción del tiempo, que hace que el consumidor ingiera en corto tiempo una cantidad mayor de la prevista. La muerte por do-- sis excesivas, como el caso de los opiáceos proviene de la de presión respiratoria, pero la depresión respiratoria por una dosis excesiva de barbitúricos no es antagonizada ni por la -

nalo: fina ni por el levalorfán.

En contraste con la toxicomanía del opio, el daño directo - para el individuo y para la sociedad proviene más de los efectos tóxicos del medicamento que la dificultad para obtener y sostener una provisión constante. (8)

SINDROME DE ABSTINENCIA

El síndrome de abstinencia de barbitúricos es uno de los síndromes de supresión medicamentosa más peligrosa. Evoluciona - - desde la debilidad, la inquietud, el temblor y el insomnio, hasta los calambres abdominales, náuseas, vómitos, hipertermia, blefaroclonia (reflejo de parpadeo clónico) Hipotensión ortostática, confusión, desorientación y finalmente crisis convulsivas mayores. El síndrome se confunde a veces con el "delirium tremens" de supresión alcohólica. La crisis pueden prolongarse, como en un estado epiléptico.

La hipertermia y la agitación a veces originan agotamiento y colapso cardiovascular, con los barbitúricos de acción breve las convulsiones tienen particular tendencia a aparecer al segundo o tercer día de abstinencia; con los barbitúricos de acción prolongada las convulsiones son menos probables y suelen aparecer entre el tercero y octavo día.

El tipo barbitúrico de síndrome de abstinencia se observa en un adicto a quién se le suprime la heroína y que insiste en que no ha tomado ningún otro medicamento. En tales casos hay que - - sospechar que el lote de heroína que empleó por última vez el - - paciente había sido diluido con barbitúricos, hecho bien conocido. Entonces hay que establecer inmediatamente un régimen de supresión

de barbitúricos.

SUPRESION DE BARBITURICOS.

Se recomienda la hospitalización durante todo el período de supresión. En lugar de aceptar la afirmación del toxicómano que indica la cantidad de barbitúricos que está acostumbrado a tomar, se efectúa una prueba objetiva con el fin de determinar el nivel de tolerancia para los barbitúricos. Se administra una dosis terapéutica ordinaria de pentobarbital y se observan en el paciente los signos clínicos del efecto del producto. Si la acción sedante de la droga no aparece muy pronto, se admite que el nivel de tolerancia de dicho paciente es más elevado y que está acostumbrado a tomar dosis aisladas más fuertes. Se administran dosis crecientes de pentobarbital hasta que el efecto del medicamento resulta evidente, al llegar a este punto, se considera la dosis total de barbitúrico administrado como línea basal a partir de la cual se irán disminuyendo las dosis subsiguientes durante siete a catorce días. Se recomienda un período de supresión prolongado para reducir al mínimo la probabilidad de que aparezcan convulsiones.

SEDANTES NO BARBITURICOS.

Glutetimida. Se produce neta dependencia física, que resulta en un grave síndrome de abstinencia caracterizado por náusea, vómito, calambres abdominales, taquicardia, hipertermia, disfagia y crisis convulsivas mayores.

Hidrato de cloral. Se desarrolla dependencia física moderada que se manifiesta por la aparición de un "delirio de cloral" al suprimir bruscamente el producto, agitación, confusión, desorientación, y alucinaciones produciéndose tolerancia ligera o moderada: "supre

sión de tolerancia", puede resultar de trastornos bruscos del mecanismo de desintoxicación hepática, produciéndose dosis excesiva y muerte.

Metiprilon. La supresión brusca ha causado confusión, agitación, alucinaciones y convulsiones generalizadas.

Paraldehido. Se desarrolla dependencia física moderada, se manifiesta por síntomas de supresión, que incluyen temblor, alucinaciones visuales y auditivas y un estado de agitación y desorientación similar al del delirium tremens.

Bromuros. No se ha demostrado dependencia física en dosis bajas los bromuros actúan como sedantes, en dosis tóxicas, producen la llamada psicosis brómica, caracterizada por confusión, desorientación, alucinaciones vivas y finalmente, la lenta eliminación de los bromuros puede ser causada de acumulación crónica cuando se administran durante cierto tiempo, con comienzo brusco del síndrome tóxico.

ACCION DE LOS BARBITURICOS.

Esta acción consiste en una inhibición del sistema nervioso central la cual se manifiesta en forma de efecto sedante.

El sueño provocado por los barbitúricos semeja objetiva y subobjetivamente el sueño fisiológico junto al efecto inhibitor central, los barbitúricos poseen una acción anticonvulsiva que se puede utilizar para el tratamiento de estados de hiperexcitabilidad motora, convulsiones epilépticas, intoxicaciones por anestésicos locales, pentetazol, etc. Solamente unos pocos barbitúricos (metilfenobarbital y fenobarbital) poseen una acción antiepiléptica específica.

Los barbitúricos no tienen ningún componente analgésico pero en combinación con él puede reformar el efecto calmante del dolor. En la médula espinal inhiben las interneuronas, los reflejos espinales son inhibidos únicamente en - -

concentraciones muy elevada, estos inhiben la actividad del centro respiratorio a dosis puramente hipnóticas. Los barbitúricos tanto en forma de ácido como de sales son fácilmente absorbidos en el tubo digestivo, en la sangre se unen a las proteínas, solo los derivados alquílicos y los tiobarbitúricos se disuelven fácilmente en las grasas, los barbitúricos restantes desaparecen del organismo por destrucción y eliminación renal, la cantidad que se elimina sin experimentar modificación es muy variable según los distintos barbitúricos, la destrucción química en barbituratos tiene lugar principalmente en el hígado siendo conocidos los siguientes procesos: Oxidación y pérdida de los radicales alquilos en la cadena lateral de posición.

DIGITALICOS O GLUCOSIDOS CARDIOTONICOS EN ODONTOLOGIA.

Son aquellas sustancias que permiten realizar al corazón - - insuficiente, el mismo trabajo con menor volumen, o sea menor consumo de oxígeno, ó bien mayor trabajo con el mismo gasto de energía o tono del miocardio.

La definición puede ser esta: Los cardiotónicos son sustancias que aumentan la eficiencia mecánica o tono y la fuerza de contracción del músculo cardíaco. (5, 6, 7, 8)

Numerosos extractos de plantas que contienen glucósidos cardíacos han sido empleados por los indígenas de varias partes del mundo como venenos de flechas.

La escila era empleada como medicamento por los antiguos - - egipcios, como se menciona en el papiro de EBERS (aprox, 1500 A.A.C.

Los romanos la usaban como diurético, tónico cardíaco, emético y veneno para ratas. El estrofantó fué introducido en medicina

por Sir Thomas Fraser (1890), que descubrió su acción digitalica cuando estudiaba en Africa los venenos de las flechas. Los Chinos utilizan desde hace siglos la piel seca de sapo común - como medicamento; es llamada Chán Su, y la recomiendan especialmente para el dolor de muelas y la hemorragia de encías, aplicación interesante por que se adelantó mucho la demostración de - que la piel de sapo contiene un gran porcentaje de adrenalina, hemostático local.

La digital o dedalera era mencionada en 1250 en escritos - de médicos galeses. Leonhard Fucks (1542) hizo la primera descripción botánica de la planta. El nombre científico Digitalis elude al calor y la forma de flor, que semeja un dedal.

Fué usada internamente o en aplicaciones locales para diversas enfermedades no relacionadas entre sí, desde epilepsia hasta - úlcera cutánea.

PREPARADOS PARA USO CLINICO:

POLVO DE DIGITAL.

TIKTURA DE DIGITAL, que en otro tiempo tuvo mucho uso, ya no es preparado oficial.

QABAINA.

DIGITOXINA.

DIGOXINA.

LANATOSIDO

DESLANOSIDO.

ACETILDICITOXINA.

DITALINA.

PREPARADOS PARA USO CLINICO CON NOMBRES COMERCIALES:

Oabafina, U.S.P. (TALUSIN), Estrofantina G La inyección - de oabafina, U.S.P. es una solución acuosa estéril para aplicación intravenosa, que contiene 0.25 ó 0.5 mg / 2 ml del medicamento. - - Aunque la oabafina es un glucósido puro, debe valorarse por el método biológico de la digital, utilizando como material de referencia un preparado de patrón de oabafina. Hay diversos preparados galénicos de estrofanto y de escila que ya no son oficiales.

Digitoxina pura o una mezcla de glucósidos cardioactivos de digitalis purpúrea, entre los que predomina la digitoxina. Las tabletas de digitoxina, U.S.P., para administración oral, contienen 0.05 ó 0.1, 0.15, 0.2 ó 0.25 mg, para administración intravenosa - es una solución estéril de digitoxina en alcohol de 40 ó 50 %, - - puede contener también glicerina. Cada mililitro contiene 0.2 mg de glucósido. Hay pruebas de que los preparados comerciales de digitoxina cristalizada varían algo en potencia entre sí. Con pesos iguales, la digitoxina es 1000 veces más potente que la digital U.S.P.; 0.1 mg de glucósido equivale a 0.1 g del polvo oficial.

Digoxina, U.S.P. (LANOXIN). Este glucósido de las hojas de digitales lanata se emplea por vía oral o por vía intravenosa. Las tabletas de digoxina U.S.P., contienen 0.25 ó 0.5 mg cada una. El elixir de digoxina, U.S.P., contiene 0.05 mg/ml. La inyección de digoxina U.S.P., es una solución estéril de digoxina de 2 ml con 0.25 mg por ml.

Lanatósidio C.H.F. (CEDILANID); Es un glucósido precursor - obtenido de las hojas de digitales lanata. Solo se expende para administración oral. De 4 a 12 ml por vía intravenosa en 24 horas, o de 2 a 6 ml ó de 2 a 12 grageas.

IRIDIOPATICOS (DIGITALICOS)

CEDIGOCINA

acetil-digoxina

cardiotónico de efecto rápido por vía oral.

INDICACIONES: Tratamiento por vía oral de la insuficiencia cardíaca y los trastornos del ritmo.

CONTRAINDICACIONES: Idiosincrasia a la digital, taquicardia ventricular, corazón beribérico, calcioterapia.

REACCIONES SECUNDARIAS: Anorexia, náuseas, vómito alteraciones del ritmo cardíaco.

FARMACOLOGÍA:

Dosis de saturación: 4 comprimidos al día durante 4 ó 5 días.

Dosis de mantenimiento: 1 ó 2 comprimidos al día.

PRESENTACION: Envases con 25 comprimidos. 1 comp. = 0.25 mg de acetil digoxina. (4)

ACYLANID: Acetil-digoxina

cardiotónico de efecto bradicardizante potente.

comprimidos de 0.2 mg.

INDICACIONES: Insuficiencia cardíaca congestiva, insuficiencia cardíaca con trastornos del ritmo, (fibrilación auricular, flutter, taquicardia paroxística .)

CONTRAINDICACIONES: Idiosincrasia a la digital, taquicardia ventricular, corazón beribérico, calcioterapia.

REACCIONES SECUNDARIAS: Anorexia, náuseas, vómito, alteraciones del ritmo cardíaco.

OSIS:

aturación rápida: Por vía oral 1.ª a 2.4 mg en 24 horas de 3 a 5 días.

aturación lenta: 3 a 5 comprimidos, en 24 horas de 3 a 5 días

de mantenimiento: 1/2 a 1 1/2 comprimido, en 24 horas.

PRESENTACION: Envases con 20 comprimidos. (4)

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS.

Con el desarrollo de drogas altamente específicas en su actividad farmacodinámica han surgido serios problemas de interacción medicamentosa que complica y dificulta la labor diaria del clínico. Estos problemas, que aumentan con el nacimiento de cada nueva droga requieren casi siempre una información y solución inmediata.

DROGA PRESCRITA	PACIENTE TRATADO CON	POSIBLE INTERACCION MEDICAMENTOSA.
ANALGESICOS	Anticoagulantes	Posible no comprobado
ASPIRINA	Acido para aminosalilicilico Fenobarbital	inhibición de la acción analgésica.
MEPERIDINA	Atropina Inhibidores de la MAO (antidepressores) Fenotiazina Promazina	Disminuyen la inhibición de la MAO.aumento de la actividad de la meperidina. Incremento de la sedación
	(3, 10, 11, 13, 16, 18)	vía IM. o IV. posible colapso.

LOGA
DESCRITA

PACIENTE TRATADO
CON

POSIBLE INTERACCION
MEDICAMENTOSA.

FINA

Inhibidores de la MAO
(antidepresores)

Potenciación del efect
to analgesico.

ENILBUTAZONA

Antiácidos
Anticoagulantes
Sulfonilureas

Inhíbe el efecto de la
fenilbutazona.
Potenciación del efecto
anticoagulante.
Potenciación del efecto
de la sulfonilurea.

FENIRAMIDOL

Bishidroxicumarina
Difenilhidantoína

Potenciación del efecto
de la Bishidroxicumarina
y de la Difenilhidantoína

PROPOXIFENO

Orfenadrina

Estimulación del S.N.C.
(ansiedad, confusión -
mental, temblores).

ANTIBIOTICOS

CLORANFENICOL

Penicilina

Inhibición de las penil
cillinas en las infeccion
es neumococcicas.

Alcohol

(3, 10, 11, 16, 18)

Inhíbe la acción de la
furazolidona probable-
(no comprobada) crisis
hipertensiva.

RAZOLIDONA

Amfetamina	Potencia la actividad de la amfetamina.
Anestésicos	Incrementa la actividad del S.N.C.
Antiparkinsonianos	
Barbitúricos	Potencia los barbituricos
Hidrato de cloral	
Cocaina	Potencia la acción de la cocaina.
Alimento conteniendo	
Tiramina	
Insulina	Potencia la acción de la insulina.
Meperidina	Potencia la meperidina.
Difenoxilato	Potencia el Difenoxilato
Metildopa	hipotensión, excitación
Fenotiazina	Potencia la fenotiazina
Reserpina	Excitación
Simpaticomiméticos	Potencia los simpatico-miméticos. Probable (no comprobados.)
Tiazidas	Potencia la Fura-olidona.
Antidepresores	Potencia la actividad antidepresora

(3, 10, 11, 12, 16, 18)

A ICRITA	PACIENTE TRATADO CON	POSIBLE INTERACCION MEDICAMENTOSA
SEOFULVINA	Anticoagulante Fenobarbital	Posible inhibición de los anticoagulantes Inhibe la acción de la Griseofulvina
DO NALIDIXICO	Antiácidos	Inhibe la acción del - ácido nalidixico
NICILINA G	Antiácidos Cloranfenicol Tetraciclina	Inhibe la actividad de la Penicilina
ULFONAMIDAS	Antiácidos Anticoagulantes Sulfanilureas	Inhibe la actividad de las sulfonamidas Potencia la actividad anticoagulante. Potencia la actividad de los sulfonilureas.
ETRACICLINAS	Antiácidos Penicilinas	Inhibición de las tetra- ciclinas.
ANTICOAGULANTES	Esteroides anabólicos (noretandrolona) (3, 10, 11, 16, 18)	Potencia la acción - anticoagulante.

DROGA
PRESCRITA

PACIENTE TRATADO
CON

POSIBLE INTERACCION
MEDICAMENTOSA

Antibióticos

Clofibrato

D-tiroxina

Potencia la acción
Anticoagulante.

Indometacina

l-tiroxina

Metilfenidato

Fenilbutazona y sus

Derivados

Feniramidol

Quinidina

Quinina

Potenciación anticoa-
gulante.

Reserpina

Salicilatos

Sulfonamidas

Tioracil

Tolbutamida

ACTH y corticoesteroides

Antiácidos

Barbitúricos

Colestiramina

Hidrato de Cloral

Glutetimida

Griseofulvina

Inhibición de los an-
ticoagulantes.
(3,10,11,16, 18)

WARFARINATO DE SODIO

DROGA
PRESCRITA

PACIENTE TRATADO
CON

POSIBLE INTERACCION
MEDICAMENTOSA

Haloperidol

Meprobamato

Anovulatorios

Cloropropamida

Difenilhidantoína

Tolbutamida

DIFENILHIDANTOINA

Bishidroxicumarina

Potenciación de la

Feniramidol

Difenilhidantoína

Hidrocortisona

Inhibición de la -
hidrocortisona

Fenobarbital

Inhibición de la -
difenilhidantoína.

DIGITAL

Calcio

Aumenta la toxicidad

Diurético tiazídico

de la digital

(3, 10, 11, 16, 1F)

SHOCK

El shock es un estado progresivo de perfusión hística inadecuada, producida por insuficiencia circulatoria, que requiere tratamiento inmediato para evitar el deterioro de órganos importantes.

TRATAMIENTO DEL SHOCK.

PRINCIPIOS BASICOS: En razón de que el shock es una entidad clínica progresiva, es necesario iniciar su tratamiento lo más pronto posible, inmediatamente la colocación de un cateter intravenoso central, en seguida se inserta una sonda vesical para controlar la eliminación urinaria que indica, de manera indirecta, el grado de perfusión hística, siempre que no exista lesión renal previa. Como la hipoxia celular es una secuela del estado de shock, hay que administrar oxígeno mediante máscara, pero si existe obstrucción de las vías respiratorias, se recurre a la intubación endotraqueal y sólo en casos excepcionales, se efectúa la traqueotomía. En seguida se procede a practicar un rápido examen físico mientras se investigan antecedentes con el propósito de identificar si es posible, la causa del shock, su duración y la existencia de enfermedades previas (cardíacas, renales hepáticas ó endocrinas). Se registran cuidadosamente los signos vitales.

También es necesario hacer un electrocardiograma y radiografías de tórax, lo mismo que determinar la hemoglobina, hematócrito, electrólitos y gases arteriales y si es posible, la lactoacidemia.

Esta última prueba, junto con el déficit de base, es un índice útil para identificar el pronóstico. Otros exámenes de laboratorio que sirven en estos casos son: glucemia, creatinina, nitró -

geno ureico y hemoclasificación.

SHOCK HIPOVOLEMICO.

Cuando existe una disminución en el volumen circulante, independientemente de su causa (puede ser hemorragia, trauma, quemadura, diarrea), hay disminución en el retorno venoso al corazón y por consecuencia disminuye el gasto cardíaco, lo que ocasiona una caída de la presión arterial.

Su causa más frecuente es la hemorragia aunque puede ser producida por pérdida de plasma y líquidos, como sucede en casos de quemaduras, peritonitis o pancreatitis aguda.

Sus síntomas están en relación directamente proporcional con la magnitud y velocidad con que se pierde un líquido determinado y consiste en: diaforesis, piel fría, agitación, taquicardia, oliguria, y aumento de la frecuencia y profundidad respiratoria.

Su diagnóstico se hace clínicamente y no existen pruebas de laboratorio para confirmarlo.

PRINCIPALES MECANISMO COMPENSATORIOS EN EL SHOCK HIPOVOLEMICO.

HIPOVOLEMIA:

Disminución del retraso venoso.

Reducción del gasto cardíaco.

Disminución de la presión arterial.

La presión arterial baja estimula los receptores hemostáticos en los senos carotídeos y arco que producen vaso constricción arterial y venosa selectiva y aumentada la frecuencia del pulso.

Simultáneamente aparece una respuesta endócrina que se caracteriza por aumento de la secreción de las hormonas antidiuréticas adrenocorticales, catecolaminas y aldosterona.

El gasto cardíaco se redistribuye con disminución de irrigación en piel, riñones y músculo esquelético y aumento en cerebro y corazón.

Se inicia una reabsorción compensatoria de líquidos hacia el lecho intravascular.

TRATAMIENTO:

El tratamiento consiste en la reposición del volumen perdido y el líquido de elección depende de sus causas. Si es debido a hemorragias se empleará sangre. Sin embargo la experiencia ha demostrado que la reanimación de estos enfermos se logra mejor con la combinación de sangre y soluciones hidroelectrolíticas.

Si la pérdida ha sido plasma, se emplean soluciones hidroelectrolíticas junto con pequeños volúmenes de solución que contenga proteínas. (8, 9, 12).

SHOCK SEPTICO.

Cuando la agresión es causada principalmente por germen gram negativos su fisiopatología está dada por la liberación en una endotoxina que combinada con leucocitos forman una sustancia de acción simpaticomimética muy potente que entre otros efectos dan lugar a una vasoconstricción víscero cutánea.

SECUENCIAS PRINCIPALES EN LA FISIOPATOLOGIA DEL SHOCK SEPTICO.

Las endotoxinas producidas por las bacterias gram negativas afectan la integridad de la pared celular. A medida que el daño progresa, hay destrucción de la pared celular. Al extenderse el destrozo se produce dilatación capilar que lleva a hipovolemia relativa iniciándose así el estado del shock.

Hipovolemia.

Disminución del gasto cardíaco.

Disminución de la perfusión capilar

Aumento de la producción de adrenalina y norepinefrina.

Vasoconstricción arteriolar y derivación arteriovenosa.

Hipoxia.

Acidosis.

Muerte celular.

TRATAMIENTO:

El pilar de este tratamiento consiste en eliminar el foco séptico. En presencia de un absceso hay que drenarlo quirúrgicamente e iniciar la administración de antibióticos sin esperar el resultado del antibiograma. Si existen antecedentes de intervención quirúrgica sobre el tracto gastrointestinal ó exploración instrumental del aparato genitourinario lo más probable es que el shock sea producto de gérmenes gramnegativos y entonces la terapia debe iniciarse con CEFALOTINA a dosis de 2 g. -- por vía intravenosa cada 6 hs. junto con sulfato de gentamicina 3 a 4 mg /kg. dfa en dosis dividida.

Debido al aumento de septicemia por gérmenes anaerobios - es aconsejable administrar 500 mg. de cloranfenicol por vía intramuscular (8, 9, 10)

SHOCK ANAFILACTICO

Entidad nosológica bien diferenciada que ocurre a razón de uno entre mil individuos. Antígeno que entra en contacto con el organismo previamente sensibilizado, siendo esta una reacción-antígeno anticuerpo existiendo liberación de sustancias vasoac-tivas potentes las cuales actúan a nivel de los lechos vícero-cutáneos existiendo una hipotensión y manifestaciones clínicas. (1, 8, 9, 10).

DIFERENTES CUADROS CLINICOS EN EL SHOCK ANAFILACTICO.

COLAPSO CIRCULATORIO:

Rash

Ansiedad.

Cefalea.

Zumbido de oídos (Acufenos).

Debilidad.

Síncope.

Convulsiones.

Palidez.

Taquicardia.

Pulso frecuente y filiforme.

Hipotensión.

OBSTRUCCION CIRCULATORIA.

Enrojecimiento de la cara, estornudo, prurito de la garganta, sensación de sofocación.

Cianosis.

Síncope y convulsiones.

TRATAMIENTO:

Este tipo de shock se caracteriza por la iniciación súbita de taquicardia, urticaria, náusea, vómito y colapso vascular, -- después de exposición a sustancias antigénicas.

Lo más importante en estos casos es reconocer su origen, - e iniciar la terapia con 0.05 ml de solución de EPINEFRINA del - 1 a 1,000 por vía intravenosa. Si es secundario a una infección- se coloca un torniquete proximal y se aplica 0.3 ml de solución- acuosa de EPINEFRINA en el mismo lugar de la infección.

Como se producen cambios de grandes volúmenes de líquidos- e hipovolemia, hay que aplicar líquidos intravenosos en dosis ma- sivas.

Además, hay que asegurar una ventilación pulmonar adecuada; es útil también la administración de 250 a 500 mg de AMINOFILINA, junto con 50 a 100 mg. de CLORHIDRATO DE DIFENHIDRAMINA. La apli- cación de corticoesteroides y antihistamínicos se continúa hasta- que cedan los síntomas (1, 8).

SHOCK CARDIOGENO.

Se trata de una entidad nosológica a la cual podemos diferenciar cuando existe un daño en la bomba cardíaca, el gasto cardíaco -- disminuye, dando lugar a una caída en la presión arterial y los- receptores transmiten esta información a los centros simpáticos del S.N.C.

La respuesta simpático adrenal iniciada por estos centros - simpáticos es idéntica a la desencadenada cuando existe hipovole- mia o sepsis; existe un aumento en la resistencia periférica - - adrenal y una disminución en el gasto cardíaco, si la congestión

progresará existirá estancamiento en la micro-circulación involu-
rando principalmente las áreas viscerocutáneas, resultando un
cuadro clínico caracterizado por extremidades frías, oliguria y
en un periodo de tiempo que puede ser variable, hipotensión.

CAUSAS DEL SHOCK CARDIOGÉNO.

Oclusión de la vena cava.

Embolia gaseosa.

Ruptura del tabique interventricular.

Embolia pulmonar.

Lesión valvular avanzada.

Infarto del miocardio.

Taponamiento cardíaco.

Ruptura de un músculo papilar.

Ruptura del corazón.

TRATAMIENTO.

La presencia de shock después de un infarto del miocardio,
constituye un signo de mal pronóstico y a pesar de los adelantos
de su tratamiento la mortalidad oscila entre el 70 y 80%. El
propósito de la terapia en estos casos es mejorar la contracti-
lidad en miocardio, disminuir el trabajo del corazón, reducir la
resistencia vascular periférica y mejorar la represión diastóli
ca y la perfusión coronaria.

Un punto importante en la terapia del shock cardiogénico en
el tratamiento de las arritmias cardíacas que incluye el uso de
cardioversión y el empleo de drogas como el clorhidrato de lido
caina y la difenil hidantoína (1, B); Corticoesteroides a do-
sis masivas de 30 mg. por kg / peso.

EXTRANOL

DESCRIPCION: Dextranol 40 es una solución de dextran de bajo peso molecular, para administración por vía venosa. Actúa mejorando el flujo sanguíneo, en particular la microcirculación.

INDICACIONES, ADMINISTRACION Y POSOLOGIA.

Dextranol 40 se administra solamente por inyección intravenosa.

Es estado de Shock (hemorrágico, cardiogénico, séptico), se sugiere que la dosis total no exceda de 20 ml / kg. durante las primeras 24 horas, los primeros 10 ml. / kg. pueden ser administrados tan rápidamente como sea necesarios, para lograr mejoría. Se recomienda con énfasis que la presión venosa central sea controlada frecuentemente durante la inyección inicial del medicamento. Si la terapéutica tuviera que prolongarse por más de 24 horas, la dosificación subsecuente no deberá exceder de 10 ml / kg. por día.

En perfusión extracorpórea, la dosificación de Dextranol 40 variará de acuerdo con el volumen del oxigenador de bomba Dextranol puede servir como líquido de purgado inicial o como aditivo de otros líquidos cedantes. Generalmente, se agregan al circuito de perfusión de 10 a 20 ml. de una solución de dextrán al 10% (1 a 2 mg), por kilogramo de peso corporal. La dosis total no deberá exceder de 2 g. / kg.

CONTRAINDICACIONES: Dextranol 40 está contraindicado en casos de trombocitopenia marcada, hipofibrinogenemia y en padecimientos renales con oliguria o anuria grave.

REACCIONES SECUNDARIAS: La antigenicidad de los tranes está relacionada directamente a su grado de ramificación. Como es de Dex-

ranol 40 es bajo, carece relativamente de efecto antigénico: sin embargo, en algunos casos se han observado reacciones leves de urticaria. Muy rara vez suele haber reacciones más graves que consisten en urticaria generalizada, opresión torácica, jadeo, hipotensión, náuseas y vómitos. Los síntomas y signos de reacción sistémica adversa se alivian administrando por vía parenteral - antihistamínicos, efedrina o noradrenalina mientras se instituyen otras medidas contra el shock .

Uso en embarazo. No se ha establecido la inocuidad de Dextranol 40 en relación con efectos adversos sobre el desarrollo del feto. Por lo tanto, no debe usarse a principios del embarazo o en mujeres en edad de concebir, a menos que a juicio del médico los beneficios potenciales superen a los posibles riesgos.

PRESENTACION: Dextranol se presenta en frascos de 500 ml. en dos tipos:

DEXTRANOL 40-D (Dextrán 40 al 10% de dextrosa al 5%)

DEXTRANOL 40-S (Dextranán 40 al 10% en solución salina isotónica)

FLEFEX.

Liofilizado.

FORMULA: FLEFEX "100"

Cada frasco ampula con liofilizado contiene:

Succinato sódico de hidrocortisona equivale a 100mg.
de hidrocortisona base.

Excipiente c.b.p.....138.1mg

Cada ampolleta de solvente contiene:

Etil mercuritiosalicilato de sodio (Conservador)..... 0.084mg

Solución isotónica del cloruro de sodio.

FORMULA: FLEMEX "500"

Cada frasco ampula con liofilizado contiene:

uccinato sódico de hidrocortisona equivalente a	500 mg.
e hidrocortisona base	710.5 mg
xcipiente c.b.p.	

Cada ampolleta con solvente contiene:

titl mercuritiosalicilato de sodio (conservador.)	0.160 mg.
solución isotónica de cloruro de sodio	5 ml.

ACCION E INDICACIONES: Puede ser eficaz salva vidas en casos de "shock" que no responde a la terapia "anti-shock" estandar o fallo circulatorio. Crisis adenosiana o insuficiencia suprarrenal aguda. Reacciones agudas de hipertensión, tales como estados asmáticos " reacciones alérgicas a drogas, lupus eritematoso "diseminado. Infecciones extenuantes de severa toxicidad.

Puede usarse también en shock operatorio y shock traumático en pacientes debilitados, y para prevenir estados agudos de insuficiencia adrenal.

CONTRAINDICACIONES Y REACCIONES SECUNDARIAS: Exactamente las mismas que en terapia corticoesteroide. Sin embargo, debido a su efecto de salva-vidas en shock esto no se toma en cuenta pues es mayor el beneficio que el trastorno que causa.

ADMINISTRACION Y POSOLOGIA: Puede ser administrada por vfa intravenosa en la iniciación de casos de urgencia. La dosis inicial deberá de ser de 100 a 200 mg. dependiendo de la severidad del padecimiento. En shock la dosis podrá ser de 500 mg. o más en 24 horas.

PRESENTACION: Frasco de 10 ml. y ampolletas de 2 ml.

Frasco de 20 ml. y ampolleta de 5 ml. (4)

IMINATE (Albumina sérica normal)

FORMULA:

Albumina de suero normal humano.....	0.25	mg.
acetiltriprifanato de sodio (Estabilizador).....	0.0052	g.
aprilato de sodio (estabilizador).....	0.033	g.
agua inyectable c.b.p.	1	ml.

INDICACIONES:

Tratamiento fisiológico del shock y de Hiperproteinemias.

PRECAUCIONES:

En excesiva deshidratación, la albúmina debe ser administrada con o seguida de líquidos adicionales.

CONTRAINDICACIONES:

Anemias severas o insuficiencia cardíaca.

REACCIONES SECUNDARIAS:

Son infrecuentes y cuando se presentan suelen deberse a sobrecargas circulatorias o anemias: escalofríos y fiebre, urticaria, variantes en las constantes vitales.

DOSIS:

2 ml/kg/peso cuando se administra por vía intravenosa, desplazará a la circulación, dentro del 15 minutos un volumen de líquidos 3.5 veces mayor que la albúmina administrada, excepto cuando el paciente está severamente deshidratado.

DETASON

FORMULA:

21 = FOSFATO DISODICO DE DEXMETASONA.....	4	mg.
Vehículo c.b.p.	1	mg

INDICACIONES:

shock anafiléctico, asma bronquial manifestaciones alérgicas.

CONTRAINDICACIONES:

Diabetes mellitus, estado convulsivo, tuberculosis no convulsiva, psicosis grave, úlcera péptica activa, insuficiencia hepática - - activa, hipertensión.

REACCIONES SECUNDARIAS:

Cara de luna, aumento de peso y apetito, insomnio irritabilidad - nerviosismo, euforia.

POSOLOGIA:

1 o 2 ml por vía intramuscular o endovenosa repitiendo la inyec - ción en intervalos de 4 a 6 horas localmente de 0.5, a 2.0 ml. - - intraarticularmente.

PRESENTACION:

FRASCO CON 2 ml.

BIBLIOGRAFIA.

- 1.- Actualidades médicas (1977 Enero a Diciembre) Anticoagulantes.
Vol. VIII No. 1, 2, 3, 4, 5, 6, suplemento.
Vol. IX No. 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8 suplemento
- 2.- Atención Médica (1977 Enero a Diciembre)
Diciembre de 1978 año VIII No. 1 Pág. 22
Enero de 1978 año IX No. 1 Pág. 9
Febrero de 1978 año IX No. 2 Pág. 28
Marzo de 1978 año IX No. 3 Pág. 38
- 3.- Drug, Interaction panel (Mzi Von Ketal) Deug
Interacción That con affect you patteuts, Patirntcotf
1: 12 Nov. 1967
- 4.- Diccionario de Especialidades Farmacéuticas (PLM)
Edición 21a pág. 400, 22a pág. 825, 23a pág. 900, 24a pág. 1150, 25a pág. 926
- 5.- Farmacología Terapéutica; Goodman 2a. Edición
1975 páginas 328 - 335 - 485- 675 - 1005 , 1230
- 6.- Farmacología Médica: Goth 5a. Edición 1971 Pág. 324, 333, 404, 405.
- 7.- Farmacología Médica : Litter 1a. Edición 1965 Pág. 327, 380, 400, 565, 887
- 8.- Fisiología Médica: Arthur C. Guyton 2a. Edición 1960 Pág. 987, 1145.
- 9.- Goodman L. S. And Gilman A: The pharmacology.
Basis of therapeutic 3rd. ed onacamillan, New York 1965.
- 10.- Griner P. F. Warfarin and other drugs, in Brackman, J. R.
et al Patiener car 4116 ang 15-1970.
- 11.- Hartshlons E. A. Drug interaction, How Drugs, Intract., Drug intelligence
2: 17 4 July 1968.

2.- Médico Moderno; 1977 Enero a Diciembre.

Vol. XVI No. 3 Nov. 1977 Página 71, 96

Vol. XVI No. 6 Feb. 1978 Página 120

13.- Medicina de Post Grado; 1977 Enero a Diciembre.

Vol. V No. 5 Mayo 1977 Página 35

Vol. V No. 10 Octubre 1977 Página 17

Vol. V No. 11 Noviembre 1977 Página 32

Vol. VI No. 1 Página 3, 14

Vol. VI No. 2 Página 3

14.- Manual Ilustrado de Odontología (astra)

Edición 1977 Página 35, 40

15.- Nosología Básica

Dr. German Raúl Domínguez Vargas. Dra. Adela Rodríguez Mendoza 2a. Edición.

Edición 1971 Página 231, 232, 233, 365.

16.- Stroman W. T. : Epitome of Latogenic Drugs 2 nd, 1968.

17.- Tribuna Médica (Antibióticos) 1977 Julio, Diciembre: 1978 Enero a Dic.

Primer No. de Nov. 1977 Tomo XXXIII - No. 9 Página 9

Segundo No. de Enero 1978 Tomo XXXIV - No. 2 Página 33

18.- Zupko A. G. Drug interaction according Therapeutic activity (partz) -

Pharmacy time 35: 38 oct. 1969.