

The image features a background of soft, wavy, light-colored lines that create a sense of movement and depth. A large, bold, black letter 'A' is centered within a dark gray rectangular box. A vertical black line is positioned to the left of the box, and a horizontal dotted line passes through the middle of the 'A' box.

A

ACARBOSA

Antidiabéticos

Propiedades farmacológicas

Hipoglucemiante oral que inhibe la acción de las glucosidasas intestinales alfa y, en consecuencia, reduce la absorción intestinal de almidón, dextrina y disacáridos; también inhibe de manera competitiva las enzimas glucoamilasa, sucrasa y maltasa, y disminuye la secreción de polipéptidos gastrointestinales. Por estas acciones reduce las concentraciones plasmáticas posprandiales de glucosa en los diabéticos dependientes de insulina y en los no dependientes de insulina. Es más eficaz cuando la dieta tiene alto contenido de almidón y fibra, y cantidades restringidas de glucosa y sacarosa. Su absorción es muy limitada a través de la mucosa gastrointestinal (0.5 a 2%). Sin embargo, la acarbosa se degrada en sus componentes de azúcar, por la acción de las bacterias intestinales y las enzimas digestivas. La porción que se absorbe se biotransforma en el hígado y se elimina en la orina.

Indicaciones

Tratamiento de primera elección en casos de diabetes mellitus tipo II (no dependientes de insulina), en pacientes con hiperglucemia moderada (140 a 200 mg/100 ml en ayunas), obesos y no obesos. Tratamiento complementario de la insulina o de las sulfonilureas en diabetes tipo II. Tratamiento complementario en pacientes con diabetes tipo I con el fin de reducir la dosis de insulina y mantener el control de la glucemia.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en casos de hipersensibilidad a la acarbosa. También está contraindicada como tratamiento de primera elección en diabetes dependiente de insulina. No debe administrarse en casos de cetoacidosis diabética, cirrosis hepática, enfermedad intestinal asociada a problemas graves de absorción o digestión, enfermedad inflamatoria intestinal, en menores de 18 años, durante el embarazo y la lactancia. En casos de hipoglucemia en pacientes que reciben insulina o sulfonilureas en combinación con acarbosa, el tratamiento por vía oral debe llevarse a cabo con monosacáridos, ya que la presencia de glucosidasa alfa impide la absorción de disacáridos y polisacáridos. La administración simultánea de acarbosa con sulfonilureas produce una caída adicional de la glucosa sanguínea. Durante los periodos de estrés (fiebre, traumatismo, infecciones, cirugía) se puede requerir insulina para el control de la glucosa sanguínea. Evitar su administración conjunta con antiácidos, adsorbentes o enzimas digestivas, ya que modifican su actividad y reducen su efecto.

Reacciones adversas

Frecuentes: meteorismo, ruido intestinal, flatulencia, distensión abdominal, diarrea.

Poco frecuentes o raras: cefalea, mareo, vértigo, debilidad, anemia, eritema, exantema, urticaria.

Advertencias para el paciente

Tomar el medicamento después del primer bocado de las tres principales comidas del día. Informar al médico si las molestias gastrointestinales son graves; estas manifestaciones suelen disminuir conforme progresa el tratamiento.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Inicial, 25 mg tres veces al día, administrados al inicio de cada comida principal. Después, dependiendo de los niveles posprandiales (1 h) de glucosa, se puede aumentar hasta 100 mg tres veces al día en pacientes con más de 60 kg de peso.

Presentaciones

GLUCOBAY. Comprimidos. Cada comprimido contiene 50 ó 100 mg de acarbosa. Caja con 30 comprimidos de 50 ó 100 mg en envase alveolado. *BAYER.*

SINCROSA. Tabletas. Cada tableta contiene 50 ó 100 mg de acarbosa. Caja con 30 tabletas de 50 ó 100 mg. *ALPHARMA.*

ACENOCUMARINA

Anticoagulantes

Propiedades farmacológicas

La acenocumarina (micumalona, acenocumarol) es un análogo y antagonista competitivo de la vitamina K, por lo que inhibe gradualmente la síntesis hepática de los factores de la coagulación en los que interviene la vitamina K: II (protrombina), VII (proconvertina), IX (Christmas) y X (Stuart). Dicha acción depende de su capacidad para inhibir la carboxilación gamma de algunos residuos de ácido glutámico localizados en la extremidad distal de las moléculas de los factores indicados. Esto determina la disminución de los factores II, VII, IX y X. La aparición de su efecto anticoagulante total depende de la vida media de tales factores, que es de 60, 6, 24 y 40 h, respectivamente. Por lo anterior, su latencia de efecto va de 12 a 24 h; es máxima entre 24 y 38 h y se prolonga por tres a cinco días. Al igual que otros anticoagulantes del mismo tipo, la acenocumarina no tiene efecto sobre el trombo establecido ni revierte el daño tisular por isquemia. Sin embargo, sí evita el aumento del trombo y las complicaciones tromboembólicas secundarias. Se absorbe rápidamente y en cantidades significativas (60%) después de su administración oral. Se une a la albúmina plasmática (74%) y se distribuye en todo el organismo; cruza la barrera placentaria y también aparece en la leche materna. Se biotransforma en el hígado, donde se forman varios metabolitos inactivos, y se elimina a través de orina y heces. Su vida media es de 22 a 24 horas.

Indicaciones

Tratamiento y profilaxis de las afecciones tromboembólicas.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en casos de hipersensibilidad a cumarinas, hemorragia activa, deficiencia de vitamina K o C, úlcera péptica, discrasias sanguíneas y tendencia hemorrágica, nefritis aguda, endocarditis, carcinoma visceral, alcoholismo, insuficiencia hepática o renal grave, hipertensión arterial grave, úlceras y heridas abiertas, cirugía cerebral y oftálmica recientes, eclampsia y durante el embarazo. Se recomienda determinar el tiempo de protrombina antes de iniciar el tratamiento, y diariamente durante los primeros cinco días; después, dos veces por semana durante dos semanas y, más adelante, cada semana, durante uno o dos meses, hasta que la respuesta se haya estabilizado. La dieta inadecuada, las enfermedades del intestino y los antibióticos que alteran la flora intestinal causan deficiencia de vitamina K, y aumentan la actividad del anticoagulante. Interactúa con numerosos fármacos que, por diversos mecanismos, aumentan sus concentraciones (ácidos etacrínico, flufenámico, nalidíxico y acetilsalicílico y otros AINE, diazóxido, hidrato de cloral, miconazol, sulfonilureas, heparina, cefalosporinas, corticoesteroides, alcohol, alopurinol, amiodarona, cimetidina, cloranfenicol, danazol, eritromicina, mercaptopurina, metilfenidato, metronidazol, propoxifén, propranolol, ranitidina, sulindac, tiroideos, clofibrato, fenilbutazona, indometacina, sulfonamidas, sulfpirazona, quinidina) o hacen que disminuya su efecto anticoagulante (colestiramina, barbitúricos, carbamazepina, fenitoína, griseofulvina, rifampicina, estrógenos, vitamina K). Por lo anterior, es necesario determinar el tiempo de protrombina y ajustar la dosis del anticoagulante cada vez que se añada un fármaco al tratamiento. Los ancianos suelen ser más susceptibles al efecto de los anticoagulantes orales.

Reacciones adversas

Frecuentes: diarrea, flatulencia. El riesgo más frecuente e importante es la hemorragia; ésta ocurre en cualquier órgano del cuerpo. En caso de prolongación excesiva del tiempo de

protrombina, se suspenderá de inmediato el tratamiento y, si es necesario, se administrará vitamina K por vía intravenosa.

Poco frecuentes: náusea, vómito, gastralgias, leucopenia, caída del cabello.

Advertencias para el paciente

Seguir estrictamente el esquema de dosificación asignado. No ingerir ni suspender otra medicación sin autorización médica. Evitar la ingestión de alcohol y salicilatos, y cambios bruscos en los hábitos alimentarios. Informar de inmediato al médico si hay sangrado, moretones, y oscurecimiento de la orina o de las heces.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Primer día, 4 a 12 mg; segundo día, 4 a 8 mg; tercer día, 4 mg. En días subsiguientes, 4 a 8 mg cada 24 h, de conformidad con el tiempo de protrombina.

Presentaciones

SINTROM. *Tabletas.* Cada tableta contiene 4 mg de acenocumarol (acenocumarina). Caja con 20 tabletas. NOVARTIS.

ACETAMINOFÉN

Analgésicos

Propiedades farmacológicas

El acetaminofén (paracetamol) es un agente eficaz para disminuir la fiebre y para aliviar el dolor somático de intensidades baja y moderada. Ambos efectos parecen tener relación con la inhibición de la biosíntesis de prostaglandinas producida por este medicamento, y que depende de su acción inhibitoria sobre la ciclooxigenasa. Su efecto antipirético se debe a su acción sobre el centro termorregulador del hipotálamo, lo que induce vasodilatación periférica y da lugar a incremento del flujo sanguíneo en la piel, sudación y pérdida de calor. A diferencia de los salicilatos, como el ácido acetilsalicílico, carece de actividad antiinflamatoria útil. Sin embargo, tiene la ventaja de no producir irritación de la mucosa del tubo digestivo. Sus efectos antipirético y analgésico se inician en 30 min, son máximos en 1 a 3 h y persisten por 3 a 4 h. En dosis terapéuticas, se absorbe rápida y completamente desde cualquier punto del aparato digestivo. Se une poco a las proteínas plasmáticas y se distribuye en todos los líquidos corporales. Experimenta biotransformación en el hígado, en particular por conjugación, formando glucurónidos inactivos; en caso de sobredosis, también intervienen oxidasas de función mixta o monooxigenasas con las cuales se producen metabolitos intermediarios que son capaces de formar uniones covalentes con macromoléculas biológicas, dando lugar a necrosis tisular. Su excreción se produce por vía renal en forma de metabolitos conjugados, y en pequeñas cantidades de compuestos hidroxilados y desacetilados; también se elimina a través de la leche materna. Su vida media es de 1 a 4 horas.

Indicaciones

Alivio del dolor de baja a moderada intensidad, como cefalea, dismenorrea, neuralgia y migraja. Disminución de la fiebre de etiología diversa.

Contraindicaciones y precauciones

Está contraindicado en casos de hipersensibilidad al acetaminofén (paracetamol), enfermedad hepática, hepatitis viral o insuficiencia renal grave. El riesgo de hepatotoxicidad al acetaminofén aumenta en pacientes alcohólicos y en quienes ingieren inductores enzimáticos, como barbitúricos u otros anticonvulsivos. Por interacción aumenta el efecto de los anticoagulantes orales. Advuértase al paciente o, en su caso, a los familiares del niño al que se administrará, que este medicamento causa toxicidad mortal por sobredosis, por lo que sólo debe administrarse la dosificación prescrita.

Reacciones adversas

Raras: dificultad o dolor al orinar, disminución del volumen urinario, erupción cutánea, neutropenia, pancitopenia o leucopenia, cansancio exagerado, ictericia (hepatitis). Las reacciones adversas más graves se deben a sobredosis aguda y consisten en necrosis del hígado, necrosis tubulorrenal y coma hipoglucémico. Los síntomas iniciales de la hepatotoxicidad son náusea, vómito y dolor abdominal. En caso de ingestión de dosis altas de acetaminofén debe procederse a la inducción del vómito o al lavado gástrico, seguido de la administración oral de carbón activado, dentro de las primeras 4 h después de la ingesta. La administración oral del antídoto acetilcisteína ofrece ventajas si se administra antes que transcurran las primeras 10 h de la ingestión del fármaco. En caso de haber administrado carbón activado, es necesario que se elimine antes de aplicar acetilcisteína, ya que interfiere con la absorción de este antídoto.

Advertencias para el paciente

Evítese la administración de acetaminofén en dosis mayores a las prescritas. Se deberá tener especial precaución cuando este medicamento se administre a los niños; guárdese el frasco en un lugar fuera del alcance de éstos. Infórmese de inmediato al médico si se presentan náusea, vómito, dolor abdominal, diarrea, coloración amarilla de la piel, sangrado, moretones, ronchas.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. 300 a 600 mg cada 4 a 6 h. *Rectal.* 300 a 600 mg cada 4 a 6 h. En ambos casos, la dosis máxima debe ser inferior a 2.6 g en 24 h. No prolongar el tratamiento por más de 10 días.

Niños:

Oral. Hasta de tres meses de edad, 40 mg cada 4 a 6 h; de tres meses a un año, 80 mg cada 4 a 6 h; de uno a dos años, 120 mg cada 4 a 6 h; de dos a cuatro años, 160 mg cada 4 a 6 h; de cuatro a seis años, 240 mg cada 4 a 6 h; de seis a nueve años, 320 mg cada 4 a 6 h; de nueve a 11 años, 400 mg cada 4 a 6 h; de 11 a 12 años, 480 mg cada 4 a 6 h. Nunca deberán darse más de cinco dosis en 24 h ni se prolongará el tratamiento por más de cinco días.

Presentaciones

ACETAFEN. *Tabletas.* Cada tableta contiene 500 ó 750 mg de paracetamol. Caja con 12 tabletas de 500 ó 750 mg. RAYERE.

DOLVIRÁN. *Solución pediátrica.* Cada 100 ml de solución contiene 10 g de paracetamol. Caja con frasco con 30 ml de solución, medida dosificadora e instructivo. BAYER.

TEMPRA. *Solución (gotas).* Cada 100 ml de solución contiene 10 g de paracetamol. Caja con frasco con 30 ml y gotero integrado. *Supositorios.* Cada uno contiene 100 ó 300 mg de paracetamol. Caja con 10 supositorios. *Jarabe.* Cada 100 ml contienen 3.2 g de paracetamol. Caja con frasco con 120 ml y dosificador con cubierta protectora. *Tabletas para adulto.* Cada tableta contiene 500 mg de paracetamol DC. Caja con 20 o 100 tabletas de 500 mg de paracetamol. *Tabletas masticables.* Cada tableta contiene 80 ó 160 mg de paracetamol. Caja con 30 tabletas masticables. BRISTOL-MYERS SQUIBB.

ACETAZOLAMIDA

Diuréticos • Oftálmicos

Propiedades farmacológicas

Derivado de las sulfonamidas, carente de actividad antibacteriana. Se considera como prototipo de los inhibidores de la anhidrasa carbónica. Esta enzima cataliza la interconversión de dióxido de carbono y ion oxhidrilo en ion bicarbonato, y desempeña un importante papel fisiológico en los túbulos proximales del riñón y en los procesos ciliares del ojo. En el riñón, hace que aumente el volumen urinario y la excreción de bicarbonato, sodio y potasio, y obliga a que disminuya la de cloro. Estos efectos ocasionan alcalinización de la orina, reducción de bicarbonato en el líquido extracelular y acidosis metabólica. En caso de presentarse esta última condición, se reduce la respuesta renal al fármaco. En el ojo, la acetazolamida disminuye la formación de humor acuoso y, en consecuencia, la presión intraocular en pacientes con glaucoma. Reduce también la producción de líquido cefalorraquídeo por los plexos coroideos y la ocurrencia de crisis en algunas formas de epilepsia, sin que se sepa si esto último se debe a una acción directa sobre la función neuronal o a la acidosis metabólica producida por los efectos renales. La acetazolamida se absorbe bien en el intestino, alcanzándose niveles plasmáticos máximos 2 h después de su administración oral. Se fija en mayor proporción a los tejidos ricos en anhidrasa carbónica, sobre todo eritrocitos y corteza renal. El compuesto original no sufre biotransformación y se elimina por completo por el riñón en 24 horas.

Indicaciones

Como coadyuvante en el tratamiento del glaucoma crónico simple de ángulo abierto y como recurso preoperatorio en el glaucoma de ángulo cerrado. Como auxiliar en la reducción del edema en casos de insuficiencia cardíaca congestiva y en la ocurrencia de crisis epilépticas de ausencia, así como en la profilaxis sintomática del mal de montaña agudo.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en casos de hiponatremia, hipopotasiemia, acidosis hiperclorémica e insuficiencia renal o suprarrenal. No debe usarse en pacientes con glaucoma crónico de ángulo cerrado, ya que ocasiona cierre del ángulo y agravamiento del proceso patológico, que pasa inadvertido al disminuir la presión intraocular. Debe usarse con precaución en casos de insuficiencia hepática y acidosis respiratoria. La alcalinización de la orina por acetazolamida hace que aumenten los efectos farmacológicos de quinidina, anfetamina, procainamida, efedrina y antidepresivos tricíclicos, y que disminuyan los de salicilatos, barbitúricos, litio y metenammina. La acidosis por acetazolamida agrava la intoxicación aguda por salicilatos, en tanto que la hipopotasiemia reproduce el efecto arritmógeno de los digitálicos.

Reacciones adversas

Poco frecuentes: somnolencia, sedación, fatiga, mareos, desorientación, ataxia, parestesias de extremidades y boca.

Raras: dermatitis, depresión de médula ósea, cálculos renales.

Advertencias para el paciente

Puede producirse somnolencia, por lo que debe tenerse precaución al manejar automóvil o desarrollar actividades que requieran un estado de alerta. Infórmese al médico si se presenta dolor de garganta, fiebre, moretones o sangrado.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. 250 a 1 000 mg/día divididos en dos a cuatro tomas. Estas dosis se administran en días alternos, a fin de retardar el desarrollo de tolerancia a los efectos renales por acidosis.

Niños:

Oral. 5 mg/kg/día.

Presentaciones

ACETADIAZOL. *Tabletas.* Cada tableta contiene 250 mg de acetazolamida. Frasco con 30 tabletas. GRIN.

ACICLOVIR

Antivíricos

Propiedades farmacológicas

Agente sintético, análogo acíclico del nucleósido de guanina, que inhibe selectivamente la duplicación de ciertos virus, en especial del herpes simple tipos 1 y 2 (HSV-1 y HSV-2), de varicela-zoster (VZV) y Epstein-Barr (EBV). Es poco activo contra infecciones por citomegalovirus (CMV). Impide la duplicación vírica mediante inhibición de la síntesis de DNA. En una primera etapa, el aciclovir es fosforilado y convertido a monofosfato de aciclovir (aciclo-GMP), un nucleótido; esta fosforilación ocurre de manera eficaz en las células infectadas por el virus del herpes por medio de una cinasa de timidina codificada por el virus. La fosforilación es mínima en las células no infectadas, hecho que explica su selectividad relativa. Posteriormente, el aciclo-GMP se convierte, por la acción de diversas enzimas celulares, en difosfato y en trifosfato de aciclovir, el cual se incorpora a las cadenas de DNA e inhibe la polimerasa del DNA de los virus e impide su duplicación. En menor grado, también inhibe la polimerasa alfa del DNA celular. El aciclovir se absorbe lenta e incompletamente a través de la mucosa gastrointestinal. Por vía intravenosa, en dosis terapéuticas, alcanza concentraciones plasmáticas máximas de 10 mcg/ml, las cuales declinan en forma progresiva y desaparecen en unas 8 h. Se distribuye ampliamente en el organismo y alcanza concentraciones eficaces en riñones, cerebro, bazo, útero, mucosa y secreciones vaginales, líquido de las vesículas herpéticas y líquido cefalorraquídeo; en este caso, su concentración es de 50% en relación con la observada en el plasma. Además, cruza la barrera placentaria. Del producto original, 9 a 33% se une a las proteínas plasmáticas. Su metabolismo es muy complejo y se elimina en particular en la orina por filtración glomerular y secreción tubular. Su vida media es de unas 2 h y se incrementa de manera considerable en casos de insuficiencia renal. La absorción percutánea del aciclovir es muy limitada y sólo se detectan concentraciones muy bajas en el plasma de pacientes que recibieron tratamiento tópico.

Indicaciones

Infección mucocutánea, inicial o recurrente, por herpes simple (HSV-1 y HSV-2) en pacientes inmunocomprometidos. Herpes genital inicial intenso en pacientes inmunocompetentes y en pacientes inmunocomprometidos. Infección por el virus varicela-zoster en pacientes inmunocomprometidos y diseminada en pacientes inmunocompetentes.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al aciclovir, enfermedad hepática activa, y durante el embarazo y la lactancia. Es necesario ajustar la dosis, en especial con la administración parenteral, en pacientes con disfunción renal. Se recomiendan pruebas de función renal antes y durante el tratamiento. Usar con precaución en pacientes deshidratados, con anomalías neurológicas o con antecedentes de reacciones neurológicas o citotóxicas. El probenecid aumenta su vida media plasmática y sus efectos tóxicos. Cuando se usa en forma simultánea, puede aumentar el potencial nefrotóxico de otros medicamentos. La reconstitución y dilución de la presentación farmacéutica deberán llevarse a cabo en condiciones asepticas, de preferencia inmediatamente antes de la aplicación. Desechar la solución no usada.

Reacciones adversas

Frecuentes: inflamación o flebitis en el sitio de la inyección, elevación de los niveles plasmáticos de urea y creatinina.

Poco frecuentes: cefalea, náusea, diaforesis, hematuria, erupción cutánea.

Raras: confusión, alucinaciones, temblores, somnolencia, convulsiones, coma. Con la aplicación tópica, irritación local y un ardor transitorio.

Advertencias para el paciente

Informar de inmediato al médico en caso de que se presente alguna de las siguientes reacciones: erupción cutánea, cefalea intensa, hematuria, confusión, somnolencia, alucinaciones, temblor.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Herpes genital, inicial: 200 mg cada 4 h, cinco veces al día, durante 10 días. Herpes genital recurrente: 400 mg dos veces al día durante un periodo de 12 meses. Herpes zoster: 800 mg cada 4 h, cinco veces al día, durante siete a 10 días. *Infusión intravenosa.* Herpes genital inicial intenso: 5 mg/kg de peso cada 8 h durante cinco días. La solución para la infusión deberá prepararse como lo indica el fabricante y administrarse a velocidad constante durante por lo menos 1 h. Herpes simple y herpes zoster diseminado: administrar como se indica antes, durante siete días. La dosis máxima no debe exceder de 30 mg/kg de peso en 24 h. *Tópica.* Infecciones cutáneas por virus susceptibles: aplicar la crema cinco veces al día, a intervalos aproximados de 4 h, en las lesiones establecidas o inminentes, durante cinco días. No aplicar sobre las mucosas.

Niños:

Oral. Herpes simple, varicela-zoster: 600 mg/m² de superficie corporal cada 6 h durante 10 días. *Infusión intravenosa.* Herpes genital intenso inicial: hasta 12 años, 250 mg/m² de superficie corporal cada 8 h durante cinco días. La solución de la infusión debe prepararse como indica el fabricante y administrarse a velocidad constante durante por lo menos 1 h. Herpes simple: hasta los 12 años de edad, administrar como se indica antes, durante siete días. *Tópica.* Infecciones cutáneas por virus susceptibles: ver adultos.

Presentaciones

CICLOFERÓN. *Tabletas.* Cada tableta contiene 200 ó 400 mg de aciclovir. Caja con 25 tabletas de 200 mg. Caja con frasco con 35 tabletas de 400 mg. *Suspensión.* Cada 100 ml de la suspensión contienen 4.0 g de aciclovir. Frasco de 60 ml y vaso dosificador graduado (2.5, 5.0, 7.5 y 10 ml). *Crema.* Cada 100 g de crema contienen 5.0 g de aciclovir. Caja con tubo de 10 g al 5%. Caja con tubo de 5 g al 5%. *Líquido para infusión.* Frasco ampula. Cada frasco ampula contiene aciclovir equivalente a 250 mg de aciclovir. Caja con cinco frascos ampula de 10 ml cada uno. LIOMONT.

ZOVIRAX. *Tabletas.* Cada tableta contiene 200, 400 u 800 mg de aciclovir. Caja con 35 tabletas de 800 mg. Caja con 35 tabletas de 400 mg. Caja con 25 tabletas de 200 mg. *Suspensión.* Cada 100 ml de suspensión contienen 4.0 g de aciclovir. Caja con frasco de 60 ml y con pipeta dosificadora (5 ml equivalen a 200 mg de aciclovir). *Crema.* Cada gramo de crema contiene 0.05 g de aciclovir. Caja con tubo con 5, 10 ó 15 g. GLAXOSMITHKLINE.

ZOVIRAX I.V. *Frasco ampula.* Cada frasco ampula con liofilizado contiene aciclovir sódico equivalente a 250 mg de aciclovir. Caja con cinco frascos ampula con 250 mg de liofilizado. GLAXOSMITHKLINE.

ÁCIDO ACETILSALICÍLICO

Analgésicos

Propiedades farmacológicas

Fármaco sintético prototipo de analgésicos no esteroideos. Tiene propiedades analgésicas, antipiréticas y antiinflamatorias, y constituye el fármaco de referencia para la evaluación de otros compuestos que tienen este tipo de efectos. Inhibe la biosíntesis de prostaglandinas, acción que parece explicar sus efectos farmacológicos y terapéuticos, y la agregación plaquetaria, e incrementa el tiempo de sangrado; estabiliza los lisosomas y reduce la permeabilidad capilar. Además, desacopla la fosforilación oxidativa y altera el equilibrio acidobásico. En dosis altas, tiene propiedades uricosúricas e hipoglucemiantes. Es irritante para la mucosa gástrica. Por ser analgésico, alivia el dolor leve y moderado, como de cefaleas, neuralgias y mialgias. Los efectos analgésico y antipirético se logran en concentraciones plasmáticas de 20 a 100 mcg/ml, y el antiinflamatorio en concentraciones plasmáticas mayores (150 a 300 mcg/ml). Su uso crónico, a diferencia de los analgésicos opioides, no induce tolerancia ni dependencia. Se absorbe en el tubo digestivo y las concentraciones plasmáticas son máximas 2 h después de su administración oral. Se distribuye ampliamente en el organismo, incluso en los líquidos sinovial, raquídeo y peritoneal, en la saliva y en la leche materna. Penetra lentamente la barrera hematoencefálica y atraviesa rápido la placenta. Hasta 50% de la sustancia se fija a las proteínas plasmáticas. Experimenta rápida biotransformación (vida media biológica de 15 a 30 min) en plasma e hígado, hasta convertirse en ácido salicílico (AS), metabolito activo que se une en 90% a las proteínas del plasma. Este metabolito se conjuga con glicina (ácido salicílico) y una pequeña fracción se oxida hasta su conversión en ácido genticísico. Se excreta en la orina como ácido salicílico (75%) y, en menor grado, como AS (10%) y ácido genticísico (1%). La excreción renal del AS y de sus metabolitos depende del pH; en la orina alcalina se elimina hasta 85% como salicilato libre, en tanto que en orina ácida es de apenas 5 por ciento.

Indicaciones

Dolor de baja y moderada intensidad, en especial en casos de cefalea, neuralgia, mialgia, artralgia y dismenorrea. Procesos inflamatorios, como fiebre reumática, artritis reumatoide y osteoartritis. Fiebre. Profilaxis de enfermedades asociadas con hiperagregabilidad plaquetaria, como arteriopatía coronaria y trombosis posquirúrgica de venas profundas.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad a los salicilatos, en pacientes con antecedentes de úlcera péptica, hemorragia gastrointestinal y en quienes sufren trastornos de la coagulación. En los pacientes que serán sometidos a cirugía y que estén bajo tratamiento con ácido acetilsalicílico, se suspenderá su administración por lo menos una semana antes de la cirugía, para así prevenir el riesgo de hemorragia posoperatoria. No se recomienda su uso en niños con influenza o varicela, y deberá evitarse su empleo durante el último trimestre del embarazo. Hace que aumenten los efectos anticoagulantes de la warfarina e hipoglucemiante de la insulina, y de los hipoglucemiantes orales. Su metabolito activo, el ácido salicílico, compite por los sitios de unión de las proteínas del plasma con naproxén, tiroxina, penicilina, tiopental, fenitoína, sulfpirazona, triyodotironina, triptófano y metotrexato. Su administración simultánea con antiácidos disminuye la biodisponibilidad del ácido acetilsalicílico. Interfiere con la acción uricosúrica del probenecid y de otros uricosúricos.

Reacciones adversas

Frecuentes: náusea, vómito, sangrado gástrico o intestinal, prolongación del tiempo de sangrado. Hace que se prolongue la duración de la gestación y del trabajo de parto.

Poco frecuentes: ulceración gastrointestinal, síndrome de Reye en niños con enfermedad febril aguda (influenza, varicela). Con dosis altas y repetidas se presenta un cuadro de salicilismo, caracterizado por cefalea, mareo, visión borrosa, cansancio, somnolencia, temblor, inquietud, sudación, sed, zumbido de oídos, vértigo, hiperventilación, alcalosis respiratoria, acidosis metabólica, anemia, hepatotoxicidad reversible, hipoprotrombinemia, fiebre, coma, colapso cardiovascular e insuficiencia renal.

Raras: reacciones anafilactoides, anemia, anemia hemolítica, broncoespasmo, dermatitis alérgica.

Advertencias para el paciente

Tomarse con los alimentos o con un vaso lleno de agua o de leche. Se evitará el consumo de bebidas alcohólicas durante el tratamiento con ácido acetilsalicílico, ya que se incrementa el riesgo de sangrado gastrointestinal. Infórmese de inmediato al médico si se presentan zumbidos de oídos o molestias gastrointestinales persistentes.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Como analgésico y antipirético, 325 a 650 mg cada 4 h. Como antirreumático, 1 a 1.25 g cada 6 h. Fiebre reumática aguda, 1 a 1.25 g cada 4 h. Como antitrombótico, 325 mg al día.

Niños:

Oral. Como analgésico y como antipirético, dos a cuatro años: 160 mg; de cuatro a seis años: 240 mg; de seis a nueve años: 320 mg; de nueve a 11 años: 400 mg; de 11 a 12 años: 480 mg. En todos los casos, cada 4 h si es necesario. Como antirreumático, 100 a 125 mg/kg al día, divididos en cuatro a seis tomas, durante una semana. Esta dosis se reduce cada semana hasta 60 mg/kg/día, divididos en cuatro a seis tomas.

Presentaciones

ASPIRINA. Tabletas. Cada tableta contiene 500 mg de ácido acetilsalicílico. Caja con 40 y 100 tabletas. BAYER.

ASPIRINA. Tabletas efervescentes. Cada tableta efervescente contiene 500 mg de ácido acetilsalicílico. Caja con 12 y 60 tabletas. BAYER.

ASPIRINA JUNIOR. Tabletas. Cada tableta contiene 100 mg de ácido acetilsalicílico. Caja con 60 tabletas. BAYER.

ÁCIDO ASCÓRBICO

Vitaminas

Propiedades farmacológicas

El ácido ascórbico (vitamina C) es una vitamina hidrosoluble esencial para el hombre. Existe en dos formas, ácido L-ascórbico y ácido L-deshidroascórbico; ambas se encuentran en plantas verdes, tomates, frutas cítricas, patatas y, en cantidades menores, en tejidos animales. Cada 100 ml de jugo de naranja contienen 50 mg de ácido ascórbico. Los requerimientos diarios se cubren fácilmente con la ingesta de alimentos. En general, los adultos necesitan 50 a 60 mg al día; las mujeres gestantes o en etapas de lactancia, 80 a 100 mg. El ácido ascórbico es uno de los reductores más potentes que existen en forma natural en los tejidos, y actúa como cofactor en un gran número de reacciones de hidroxilación y amidación, transfiriendo electrones a las enzimas que proporcionan equivalentes reductores. Por ello, es esencial en la formación y conservación de colágena y la matriz intercelular, en la síntesis de catecolaminas, síntesis de carnitina y esteroides, en el metabolismo de la tirosina y en la conversión de ácido fólico en ácido fólnico. Asimismo, para incorporación del hierro a la ferritina y al catalizar la reducción de hierro férrico a su forma ferrosa. También es necesario para garantizar la integridad de la respuesta inmunitaria celular: aumenta la actividad fagocítica de los leucocitos y favorece la cicatrización de las heridas. Junto con el antioxidante liposoluble vitamina E, parece desempeñar una función protectora contra el daño provocado por la oxidación de moléculas esenciales. Las implicaciones médicas de esta acción están por determinarse. La deficiencia de ácido ascórbico se manifiesta por aumento de los requerimientos (embarazo, lactancia, anticonceptivos orales, situaciones de estrés, tabaquismo) en combinación con una escasa ingestión; en caso de deficiencia extrema ocurre escorbuto, que responde rápidamente al efecto terapéutico del ácido ascórbico. Se ha especulado sobre la posible utilidad del ácido ascórbico en la prevención y tratamiento del resfriado común, del cáncer, y en procesos como envejecimiento, infertilidad y enfermedades de la colágena. Sin embargo, no hay certeza de su acción benéfica. El ácido ascórbico se absorbe bien en el intestino, aun cuando su absorción disminuya en forma proporcional con dosis altas, y se distribuye ampliamente en el organismo. Se almacena en las células y alcanza concentraciones muy altas en los tejidos glandulares. Se biotransforma en el hígado, y se han identificado oxalato y sulfato de ácido ascórbico como metabolitos en la orina. Se elimina por vía renal.

Indicaciones

Prevención y tratamiento del escorbuto. Profilaxis y tratamiento de la deficiencia vitamínica (ingesta disminuida o requerimientos aumentados).

Contraindicaciones y precauciones

No se recomienda su administración, o ésta debe vigilarse estrechamente en casos de gota, cistinuria y cálculos renales. Téngase en cuenta que los diabéticos, los pacientes predispuestos a litiasis renal recurrente, aquellos con dietas hiposódicas o sometidos a tratamiento anticoagulante, no deben tomar cantidades altas de ácido ascórbico durante periodos prolongados. Su administración precipita crisis de anemia falciforme en pacientes susceptibles. También está contraindicado en pacientes con deficiencia de deshidrogenasa de glucosa-6-fosfato, ya que puede causar anemia hemolítica, y en pacientes con hemocromatosis, talasemia o anemia sideroblástica, porque aumenta la absorción de hierro. Si se suspende abruptamente la ingestión de ácido ascórbico, después de administrarlo por periodos prolongados en cantidades superiores a 250 mg/día, ocurre un fenómeno de rebote en el que los valores de esta sustancia disminuyen hasta alcanzar cantidades compatibles con es-

corbuto. También existe el riesgo de escorbuto en los productos de madres que ingirieron grandes cantidades de ácido ascórbico durante el embarazo. Como reductor, interfiere con las pruebas de laboratorio basadas en reacciones de oxidorreducción (determinaciones de deshidrogenasa láctica, transaminasa sérica y glucosa). Por otro lado, aumenta los valores de los estrógenos provenientes de anticonceptivos orales y hace que disminuya la acción anticoagulante de la warfarina.

Reacciones adversas

Con las dosis que cubren los requerimientos diarios por lo regular no se presentan reacciones adversas. En algunos individuos susceptibles aumenta la precipitación de cristales de cistina y oxalato en vías urinarias. En dosis altas (mayores de 1 g) puede causar diarrea, enrojecimiento de la piel, cefalea, aumento de la diuresis, náusea, vómito y cólico abdominal.

Advertencias para el paciente

Los suplementos vitamínicos sólo deben tomarse cuando no se obtienen suficientes vitaminas con la dieta. El empleo de cantidades excesivas de ácido ascórbico por periodos prolongados causa daños a la salud; por ejemplo, la formación de cálculos urinarios. Las dosis superiores a las recomendadas como suplemento dietético sólo deben tomarse por indicaciones del médico.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Suplemento dietético, 60 mg al día; mujeres embarazadas, 80 mg al día; mujeres que dan alimentación al seno, 100 mg al día. Tratamiento de la deficiencia, 100 a 250 mg una a tres veces al día.

Niños:

Oral. Mayores de siete años. Suplemento dietético, hasta un máximo de 50 mg al día. Tratamiento de la deficiencia, 100 a 300 mg al día en dosis divididas.

Presentaciones

CEVALÍN. *Tabletas masticables.* Cada tableta masticable contiene 500 mg de ácido ascórbico. Frasco con 12, 20 ó 30 tabletas masticables sabor fresa, o sabor naranja. *Tabletas.* Cada tableta contiene 500 mg de ácido ascórbico. Frasco con 100 tabletas. *Tabletas efervescentes.* Cada tableta efervescente contiene 1 g de ácido ascórbico. Caja con 10 tabletas efervescentes sabor limón o naranja. BAYER.

CEVALÍN INFANTIL. *Tabletas masticables.* Cada tableta masticable contiene 100 mg de ácido ascórbico. Frasco con 20 ó 100 tabletas masticables con sabores de cereza, limón o lima-limón. BAYER.

REDOXÓN. *Gotas.* Cada 100 ml contienen 20 g de vitamina C (ácido ascórbico). Cada ml equivale a 20 gotas (200 mg). Caja con frasco con 20 ml, sabor caramelo. BAYER.

ÁCIDO FÓLICO

Antianémicos • Vitaminas

Propiedades farmacológicas

El ácido fólico (vitamina B₉) es el precursor de la coenzima del ácido tetrahidrofólico que actúa como donador de metilos e interviene en reacciones de transferencia de un carbono, como: 1) conversión de homocisteína en metionina; 2) conversión de serina en glicina; 3) síntesis de timidilato; 4) metabolismo de histidina, y 5) síntesis de purinas. Por lo anterior, es indispensable en la síntesis de nucleoproteínas y en el mantenimiento de la eritropoyesis normal. El ácido fólico natural se encuentra en todos los vegetales de hoja verde y en algunas vísceras de animales, como hígado y riñón. En el adulto, los requerimientos diarios de ácido fólico son de aproximadamente 50 mcg; durante el embarazo y la lactancia, la mujer puede requerir hasta 100 a 200 mcg/día. La disminución en la ingesta de ácido fólico, o la malabsorción, conduce a anemia megaloblástica. En los alimentos, los folatos se encuentran en forma de poliglutamatos reducidos, para cuya absorción se requiere del transporte y la acción de una enzima asociada a las membranas de las células de la mucosa intestinal. La mucosa del duodeno y la parte alta del yeyuno son ricas en reductasa de dihidrofolato, que también es capaz de someter a metilación la mayor parte del folato después de reducirlo. Cuando hay malabsorción no se absorbe ácido fólico natural, pero sí el sintético, debido a que éste es un monoglutamato. Una vez que se absorben, los folatos se distribuyen a todos los tejidos y se almacenan dentro de las células, especialmente en el hígado, en forma de poliglutamatos que, debido a su carga, no se difunden hacia el líquido extracelular; cualquier exceso de ácido fólico se excreta principalmente en la orina.

Indicaciones

Anemia megaloblástica por deficiencia de ácido fólico. Prevención y tratamiento de la deficiencia de ácido fólico. En mujeres en edad reproductiva, para prevenir defectos en la formación y cierre del tubo neural en el producto.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al ácido fólico. No deben emplearse dosis mayores de 0.4 mg/día antes de descartar anemia perniciosa, la que también puede ser causada por deficiencia de vitamina B₁₂. La administración indiscriminada de ácido fólico a pacientes con ese tipo de anemias megaloblásticas mejora el cuadro hematológico, pero el daño neurológico se agrava y se vuelve irreversible si no se administra también vitamina B₁₂. La acción anticonvulsiva de fenobarbital, fenitoína y primidona se ve antagonizada por el ácido fólico, por lo que puede ser necesario aumentar la dosis del anticonvulsivo a fin de prevenir la presentación de crisis. Los pacientes que reciben ácido fólico se mantendrán bajo estrecha vigilancia médica y se ajustarán las dosis de mantenimiento si parece inminente una recaída. En casos de alcoholismo, anemia hemolítica, terapia anticonvulsiva o infecciones crónicas puede ser necesario aumentar la dosis de mantenimiento.

Reacciones adversas

El ácido fólico por vía oral no se considera tóxico y se toleran dosis altas de éste. Sin embargo, se han publicado datos de algunas reacciones alérgicas (prurito, erupción cutánea, broncoespasmo) en pacientes sensibles.

Advertencias para el paciente

Tómese sólo bajo supervisión médica. Las dosis para prevención de la deficiencia se deben lograr con alimentación adecuada.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Prevención de la deficiencia, suplemento dietético: 0.1 mg al día; en algunos casos (embarazo), se puede aumentar hasta 1 mg al día. Tratamiento de la deficiencia, inicial: 0.25 mg a 1 mg/día, hasta que ocurra respuesta hematológica. Cuando han desaparecido los síntomas clínicos y el cuadro hematológico se ha normalizado, se continúa con una dosis de mantenimiento de 0.4 mg/día; en el embarazo y la lactancia, 0.8 mg/día.

Niños:

Oral. Las dosis para prevención y tratamiento inicial de la deficiencia son iguales que las de los adultos. La dosis de mantenimiento en el tratamiento de la deficiencia en lactantes es de 0.1 mg al día; en niños hasta de cuatro años, 0.3 mg, y en niños mayores de cuatro años, 0.4 de miligramo.

Presentaciones

A. F. VALDECASAS. *Tabletas.* Cada tableta contiene 0.4 mg o 5 mg de ácido fólico. Frasco con 30, 90 ó 375 tabletas con 0.4 mg de ácido fólico cada una. Frasco con 20 ó 50 tabletas con 5 mg de ácido fólico cada una. VALDECASAS.

FOLIVITAL. *Tabletas.* Cada tableta contiene 0.4 mg ó 4 mg de ácido fólico. Frasco de polietileno con 90 tabletas de 0.4 mg (400 mcg). Caja con 90 tabletas de 4 mg. SILANES.

ÁCIDO FOLÍNICO

Antianémicos

Propiedades farmacológicas

El ácido folínico (leucovorin o factor citrovorum) es la forma reducida del ácido fólico que en el organismo se transforma rápidamente en tetrahidrofolato. De esta manera, el ácido folínico interviene en las reacciones intracelulares que utilizan folatos, sin que para ello sea necesaria la acción de la enzima reductasa de dihidrofolato. Estas reacciones, en que la coenzima del ácido tetrahidrofolico actúa como donador de metilos, son indispensables en la síntesis de nucleoproteínas y en el mantenimiento de la eritropoyesis normal, e incluyen: conversión de homocisteína en metionina, conversión de serina en glicina, síntesis de timidilato, metabolismo de histidina y síntesis de purinas. Por otro lado, el metotrexato es un análogo del ácido fólico que inhibe la reductasa de dihidrofolato y, de esta manera, impide la síntesis de DNA, RNA y proteínas, acción que explica su capacidad de inhibir la proliferación celular y, en consecuencia, su efecto antineoplásico. El ácido folínico delimita la acción inhibitoria del metotrexato sobre las células normales, compitiendo por el mismo mecanismo de transporte hacia el interior de las células. Administrado en el momento adecuado "rescata" las células normales de los efectos tóxicos de dosis altas de metotrexato. Además, antagoniza los efectos tóxicos (anemia megaloblástica) de otros inhibidores de la reductasa de dihidrofolato, como la pirimetamina y el trimetoprim que, en dosis altas, se emplean en el tratamiento del paludismo y la toxoplasmosis. El ácido folínico se absorbe bien por vía oral, se distribuye en todo el organismo, cruza la barrera hematoencefálica y alcanza altas concentraciones en el hígado. En este sitio y en la mucosa intestinal se biotransforma en un metabolito activo, 5-metiltetrahidrofolato. Una dosis de 15 mg proporciona una concentración sérica de 1 mcg. Se elimina por vía renal (80 a 90%) y fecal (5 a 8%).

Indicaciones

Tratamiento de los efectos tóxicos del metotrexato. Profilaxis y tratamiento de los efectos tóxicos de la pirimetamina y del trimetoprim.

Contraindicaciones y precauciones

No debe administrarse a pacientes alérgicos al ácido folínico. Tampoco debe emplearse en el tratamiento de las enfermedades causadas por deficiencia de ácido fólico en las que se prefiere la administración oral de éste. La administración del ácido folínico para "rescate" de los efectos tóxicos del metotrexato sólo debe llevarse a cabo bajo la supervisión de un médico experimentado en el uso de dosis altas de metotrexato. En los pacientes que han recibido quimioterapia con antagonistas del ácido fólico, y en quienes se desea disminuir los efectos tóxicos de estos antagonistas, se prefiere la administración del ácido folínico por vía parenteral, en especial si el paciente tiene vómito. Se recomienda iniciar la primera dosis de ácido folínico dentro de las primeras 24 a 42 h siguientes al inicio del tratamiento con dosis altas de metotrexato. El tratamiento de la sobredosis de metotrexato debe llevarse a cabo dentro de la hora siguiente a su administración. La excreción de metotrexato se retrasa en presencia de ascitis o derrame pleural; o bien, cuando hay insuficiencia renal o deshidratación, por lo que se recomienda vigilar la concentración sérica de metotrexato y determinar la dosis óptima y la duración del tratamiento con ácido folínico, de manera que los valores de tetrahidrofolato sean iguales o superiores a los de metotrexato. Si se administra metotrexato por vía intratecal y, al mismo tiempo, ácido folínico, la presencia de tetrahidrofolato que difunde rápidamente al líquido cefalorraquídeo puede antagonizar el efecto antineoplásico del metotrexato. No se administre el ácido folínico por vía intratecal. Vigílese estrechamente

a los pacientes que reciben en forma simultánea fenobarbital, fenitoína o primidona, pues el ácido fólnico antagoniza sus efectos anticonvulsivos. Puede aumentar la toxicidad del fluorouracilo. Las dosis excesivas del ácido fólnico antagonizan los efectos quimioterapéuticos de los antagonistas del ácido fólico.

Reacciones adversas

Se han comunicado algunas reacciones de hipersensibilidad (prurito, erupción cutánea, broncoespasmo) en pacientes susceptibles.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Intramuscular o intravenosa. Antídoto para la sobredosis por metotrexato, inmediatamente o hasta 1 h después del antagonista, 10 mg/m² de superficie corporal cada 6 h, hasta que las concentraciones de metotrexato sean menores de 5×10^{-8} M. Si a las 24 h de haber iniciado la administración del metotrexato, la creatinina sérica aumenta 50% por arriba de la línea basal o el metotrexato sérico es mayor de 5×10^{-6} M, la dosis de ácido fólnico deberá incrementarse a 100 mg/m² de superficie corporal cada 3 h por vía intravenosa, hasta que las concentraciones de metotrexato disminuyan a menos de 5×10^{-8} M. *Intramuscular u oral.* Antídoto para la toxicidad de pirimetamina o trimetoprim, prevención: 0.4 a 5 mg con cada dosis del antagonista del ácido fólico. Tratamiento, 5 a 15 mg/día.

Presentaciones

DALISOL. *Solución inyectable.* Cada ampolleta de 1 ml contiene 3 mg, cada ampolleta de 5 ml contiene 15 mg, cada ampolleta de 4 ml contiene 50 mg, cada ampolleta de 24 ml contiene 300 mg y cada ampolleta de 28 ml contiene 350 mg de ácido fólnico. Caja con seis ampolletas con 3 mg/1 ml. Caja con cinco ampolletas con 15 mg/5 ml. Caja con frasco ampula con 50 mg de ácido fólnico en 4 ml. Caja con frasco ampula con 300 mg de ácido fólnico en 24 ml. Caja con frasco ampula con 350 mg de ácido fólnico en 28 ml. Liofilizado para solución inyectable. Cada frasco ampula con liofilizado contiene folinato cálcico equivalente a 350 mg de ácido fólnico. Caja con frasco ampula con liofilizado con 100 mg de ácido fólnico en 5 ml. Caja con frasco ampula con liofilizado con 350 mg de ácido fólnico en 17 ml. LEMERY.

MEDSAVORINA. *Solución inyectable.* Cada frasco ampula con liofilizado contiene folinato cálcico equivalente a 50 mg de ácido fólnico. Caja con un frasco ampula con 50 mg. ASOFARMA.

ÁCIDO MEFENÁMICO

Analgésicos

Propiedades farmacológicas

Es un fenamato derivado del ácido *N*-fenilntranílico, el cual, como otros miembros del grupo, tiene propiedades analgésicas, antipiréticas y antiinflamatorias semejantes al ácido acetilsalicílico relacionadas con su capacidad de inhibir la biosíntesis de prostaglandinas, acción que depende de la inhibición de la ciclooxigenasa; también inhibe competitivamente la acción de las prostaglandinas y la agregación plaquetaria, y prolonga el tiempo de protrombina. Su importancia reside en que su potencia analgésica y antiinflamatoria es mayor que la del ácido acetilsalicílico; sin embargo, su toxicidad potencial limita su uso clínico. Alivia el dolor leve y moderado, como el de cefaleas, neuralgias, mialgias y dismenorrea. Se absorbe rápida y completamente a través de la mucosa gastrointestinal, alcanzando concentraciones máximas en 2 a 4 h. Se une extensamente a las proteínas plasmáticas y se metaboliza en el hígado. Se excreta en la orina, y en menor proporción en la bilis. Su vida media plasmática es de unas 2 horas.

Indicaciones

Dolor de baja a moderada intensidad. Dismenorrea.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al ácido mefenámico o a los analgésicos antiinflamatorios no esteroideos, en pacientes con hemorragia gastrointestinal, úlcera péptica, discrasias sanguíneas, durante el embarazo y la lactancia. Usar con precaución en casos de anemia, asma, retención de líquidos, diabetes mellitus, disfunción hepática o renal, hipoprotrombinemia. Aumenta los efectos de los anticoagulantes orales y fármacos trombolíticos. La administración simultánea de otros inhibidores de la agregación plaquetaria, como dextrán, dipiridamol, sulfinpirazona, ácido valproico, cefoperazona, salicilato y otros antiinflamatorios no esteroideos, aumenta el riesgo de sangrado gastrointestinal. Incrementa el efecto de los hipoglucemiantes. Sólo prescribir para tratamientos de corta duración, no mayores de una semana.

Reacciones adversas

Frecuentes: molestias y dolor abdominal, diarrea, náusea.

Poco frecuentes: anemia, dermatitis alérgica.

Raras: ulceración y sangrado gastrointestinal, cistitis, disuria, agranulocitosis, anemia aplásica, trombocitopenia, anemia hemolítica, leucopenia, petequias, hepatitis colestásica, pancreatitis, daño renal.

Advertencias para el paciente

Tómese durante la ingestión de alimentos para reducir las molestias gastrointestinales. Hay que informar de inmediato al médico si las molestias gastrointestinales son muy intensas o si se presenta edema de las extremidades. Evitar la ingesta de bebidas alcohólicas. No usar por más de una semana.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Inicial, 500 mg; después, 250 mg cada 6 h. No usar por más de una semana.

Niños:

Oral. Para mayores de 14 años, ver adultos.

A

Presentaciones

NAMIFEN. *Tabletas.* Cada tableta contiene 500 mg de ácido mefenámico. Caja con 20 tabletas de 500 mg en envase de burbuja. NOVAG.

ÁCIDO NALIDÍXICO

Antisépticos

Propiedades farmacológicas

Igual que otras quinolonas, el ácido nalidíxico actúa en el interior de las bacterias e inhibe la acción de la girasa del DNA, enzima esencial para el enrollamiento y superenrollamiento del DNA bacteriano, acción que impide su duplicación y favorece su rompimiento. Es activa contra casi todas las bacterias gramnegativas que causan infección de las vías urinarias. Entre ellas se cuenta casi 100% de las cepas de *Escherichia coli* y de *Proteus mirabilis*, 75 a 97% de otras especies de *Proteus*, más de 90% de las especies de *Klebsiella* y *Enterobacter*; también son susceptibles más de 80% de otras bacterias coliformes. Por el contrario, son resistentes al ácido nalidíxico *Pseudomonas* y buena parte de los cocos grampositivos, como *Streptococcus faecalis* (enterococo). Además, algunas de las bacterias inicialmente susceptibles rápido se vuelven resistentes al efecto de este antimicrobiano. Se absorbe casi por completo en el tubo digestivo y alcanza concentraciones plasmáticas del orden de 20 a 30 mcg/ml. Más de 90% se une a las proteínas del plasma y alcanza concentraciones muy altas (100 a 150 mcg/ml) en túbulo renales, vejiga y uretra, ejerciendo su acción terapéutica a pH urinario normal; sin embargo, no se observa actividad antibacteriana importante en el líquido prostático, por lo que no se lograrán resultados satisfactorios si la infección proviene de la glándula prostática. Tampoco se obtienen concentraciones antibacterianas eficaces en otras partes del organismo; por ello, sólo se emplea en el tratamiento de infecciones locales de las vías urinarias. Con frecuencia se asocia con fenazopiridina, un analgésico acidificante urinario, cuando la infección cursa con malestar local o dolor. Su vida media plasmática es alrededor de 2.5 h, pero aumenta hasta ocho veces en pacientes con insuficiencia renal. Su vida media en la orina es de 6 h. Parte del ácido nalidíxico sufre biotransformación en el hígado hasta convertirse en ácido hidroxinalidíxico, metabolito activo que se excreta por la orina.

Indicaciones

Tratamiento de infecciones de las vías urinarias causadas por bacterias gramnegativas susceptibles.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al ácido nalidíxico, en pacientes con presión intracraneal aumentada y durante el primer trimestre del embarazo. En general, y ante el riesgo de producir artropatías, no se recomienda su administración en niños. Debe tenerse especial cuidado cuando se administra en pacientes con antecedentes convulsivos, úlcera péptica, deficiencia de deshidrogenasa de glucosa-6-fosfato, insuficiencia hepática o renal, así como durante el segundo o tercer trimestre del embarazo. No debe asociarse a otros antisépticos de vías urinarias, ya que se ha encontrado resistencia bacteriana cruzada con el ácido oxolínico. Tampoco se administrará en el tratamiento de infecciones sistémicas, ya que en las dosis acostumbradas no es eficaz, y en dosis mayores no es seguro. Durante el tratamiento deberán realizarse cultivos consecutivos, y así asegurarse del control de la infección; si la orina no se vuelve estéril en 48 a 72 h, debe suspenderse su administración. Si a juicio del médico el tratamiento ha de prolongarse por más de dos semanas, se llevarán a cabo pruebas de funcionamiento hepático y biometría hemática, así como vigilancia de la función renal.

Reacciones adversas

Frecuentes: dolor abdominal, náusea, vómito, diarrea, cefalea, erupción cutánea, visión borrosa.

Poco frecuentes: somnolencia, vértigo, aumento de la sensibilidad a la luz solar.

Raras: leucopenia, trombocitopenia, anemia hemolítica, orina oscura, heces pálidas (ictericia colestática).

Advertencias para el paciente

Antes de iniciar el tratamiento con ácido nalidíxico, es indispensable informar al médico de cualquier síntoma o enfermedad antecedente relacionada con desmayos o convulsiones, dolor persistente o intermitente del estómago o del intestino, quemaduras por el sol, diabetes; asimismo, si es el caso, estado de embarazo. Durante el tratamiento se evitará la exposición prolongada a los rayos solares, y se impedirá alargar el tratamiento por más de dos semanas a no ser por consejo y valoración médica. Tomarlo con los alimentos si ocurren molestias gastrointestinales.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. 4 g al día, divididos en cuatro fracciones (1 g cada 6 h) durante una a dos semanas. Si el tratamiento es prolongado, disminuir la dosis diaria a 2 g al día (500 mg cada 6 h) al iniciar la tercera semana. Nunca se administrarán más de 4 g en 24 horas.

Presentaciones

WINTOMYLON. *Tabletas.* Cada tableta contiene 500 mg de ácido nalidíxico. Caja con 30. SANOFI-AVENTIS.

ÁCIDO NICOTÍNICO

Hipolipemiantes

Propiedades farmacológicas

El ácido nicotínico (niacina) es un elemento esencial de la dieta, y en el organismo se convierte en dinucleótido de nicotinamida y adenina (NAD) o en fosfato de dinucleótido de nicotinamida y adenina (NADP), formas activas que participan como coenzimas en el metabolismo de una gran variedad de proteínas que catalizan las reacciones de oxidorreducción, esenciales para la respiración tisular. Su deficiencia produce pelagra. El ácido nicotínico, en dosis elevadas, hace que disminuyan las concentraciones plasmáticas de lipoproteínas de baja densidad (LDL) y de muy baja densidad (VLDL), porque disminuye su producción. Este efecto se relaciona con diversas acciones del compuesto; entre ellas, inhibición de la lipólisis en el tejido adiposo, reducción de la esterificación de los triglicéridos hepáticos y aumento de la actividad de la lipasa. No modifica la síntesis total de colesterol ni altera la excreción de ácidos biliares. Por otro lado, aumenta las concentraciones plasmáticas de lipoproteínas de alta densidad (HDL). Su efecto sobre los triglicéridos de muy baja densidad es evidente en uno a cuatro días; en tanto que sus efectos sobre las concentraciones de lipoproteínas de baja densidad (LDL) ocurren más lentamente y se identifican después de cinco a siete días de iniciado el tratamiento. Por estos efectos, el ácido nicotínico se utiliza como tratamiento auxiliar en pacientes con hiperlipidemia. También produce vasodilatación periférica directa. Se absorbe rápido en el tubo digestivo y se distribuye ampliamente en el organismo. Se metaboliza en el hígado y sus principales metabolitos son el ácido nicotínico, la *N*-metilnicotinamida y un derivado, la 2-piridona.

Indicaciones

Tratamiento de la hiperlipidemia primaria (tipos IIa, IIb, III, IV y V) con riesgo de enfermedad coronaria y que no ha respondido a otras medidas terapéuticas (dieta, ejercicio, control de la diabetes).

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad a niacina, cuando hay gota, úlcera péptica, enfermedad hepática, glaucoma y durante el embarazo. En diabéticos altera las pruebas de tolerancia a la glucosa.

Reacciones adversas

Frecuentes: sensación de calor, eritema, especialmente en cara y nuca, prurito, dolor de cabeza, diarrea, mareos, resequedad de la piel, náusea o vómito, dolor estomacal (activación de úlcera péptica).

Poco frecuentes: erupción cutánea, hipotensión, hiperpigmentación, xerodermia.

Raras: especialmente con dosis muy altas, alteraciones de la función hepática.

Advertencias para el paciente

Aparecen rubor cutáneo y sensación de calor, en especial en la cara y el cuello, en las primeras 2 h después de la ingestión. Por regla, estos efectos desaparecen en los siguientes días. Si no es el caso, o son muy intensos, se consultará al médico. Tómese junto con los alimentos. Si hay desvanecimientos (hipotensión postural), tendrán que evitarse los cambios bruscos de posición.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Inicial, 100 mg tres veces al día e incrementar 300 mg al día, cada cuatro a siete días, hasta lograr la respuesta deseada. Mantenimiento, 1 a 2 g al día, sin exceder de 3 g en 24 horas.

Presentaciones

HIPOCOL. *Tabletas.* Cada tableta contiene 100 ó 500 mg de ácido nicotínico. Frasco con 50 tabletas de 100 mg. Frasco con 50 tabletas de 500 mg. VALDECASAS.

ÁCIDO PIPEMÍDICO

Antisépticos

Propiedades farmacológicas

Medicamento sintético, derivado de las quinolinas, que interfiere con la polimerización del DNA de casi todas las bacterias gramnegativas que causan infecciones en vías urinarias. Tiene actividad bactericida contra *Klebsiella aerogenes*, *K. pneumoniae*, *Escherichia coli*, especies de *Salmonella*, de *Shigella* y de *Brucella*, *Proteus mirabilis*, *P. vulgaris*, *Morganella morganii*, *Providencia rettgeri*, *Aerobacter aerogenes* y *Pseudomonas aeruginosa*. Es eficaz contra algunos microorganismos resistentes a los ácidos piramídico y nalidíxico. Su actividad bactericida no se modifica por un cambio de pH de 5 a 9. Después de su administración oral, su absorción es prácticamente completa y la concentración plasmática máxima es de 2.0 a 3.3 mcg/ml, 2 h después de una dosis de 400 mg. Sólo se metaboliza parcialmente en el hígado, y se elimina en forma activa en la orina, donde alcanza concentraciones bactericidas 6 h después de su administración. Su vida media es de unas 8 h, aunque puede ser hasta de 21 h en casos de insuficiencia renal. Una pequeña fracción del ácido pipemídico atraviesa la barrera placentaria.

Indicaciones

Tratamiento de las infecciones de vías urinarias agudas (simples) y crónicas (complicadas).

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al ácido pipemídico, antecedentes convulsivos, parkinsonismo, insuficiencia vascular cerebral, insuficiencia hepática o renal grave, deficiencia de deshidrogenasa de glucosa-6-fosfato, en niños, y durante el embarazo y la lactancia. Deberán reducirse las dosis en casos de alteraciones hepáticas o renales significativas. Al terminar el tratamiento, se realizará urocultivo para decidir su continuación o suspensión.

Reacciones adversas

Frecuentes: anorexia, náusea, vómito, dolor abdominal, diarrea, cefalea, vértigo, astenia.

Poco frecuentes: erupción cutánea, prurito, reacciones de fotosensibilidad.

Raras: trombocitopenia, leucopenia, anemia hemolítica, hipertensión endocraneana.

Advertencias para el paciente

Causa alteraciones gastrointestinales, por lo que debe tomarse junto con los alimentos. No exponerse al sol porque se originan reacciones de fotosensibilidad. Durante el tratamiento, tomar agua en abundancia a fin de asegurar una diuresis adecuada.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. En infecciones agudas, 400 mg cada 12 h durante 10 días. En infecciones crónicas, 400 a 800 mg cada 12 h durante 10 a 20 días.

Niños:

No se recomienda su administración.

Presentaciones

UROPIPEMID. *Grageas.* Cada gragea contiene 400 mg de ácido pipemídico. Frasco con 20 grageas. APLICACIONES FARMACÉUTICAS.

ÁCIDO RETINOICO

Dermatológicos

A

Propiedades farmacológicas

El ácido retinoico (tretinoína), que es la forma ácida de la vitamina A, es un irritante que estimula el recambio de células epidérmicas, acción que reduce la cohesión entre las células de la capa córnea y facilita su descamación. Esta acción facilita la expulsión de comedones e inhibe la formación de otros nuevos. Estos efectos determinan su utilidad en el tratamiento del acné vulgar, que resulta más eficaz cuando se asocia con peróxido de benzoilo o con antibióticos sistémicos. También normaliza la queratinización acroinfundibular y, por ello, se utiliza en el tratamiento de las verrugas planas, queratosis folicular e ictiosis. Por otro lado, se ha informado que la tretinoína es útil para revertir algunas de las manifestaciones de fotoenvejecimiento; sin embargo, este efecto requiere de estudios más formales para establecer su verdadera eficacia. Un porcentaje reducido (5%) se absorbe cuando se aplica en la piel, y aumenta cuando se aplica en zonas extensas o por largos periodos. La porción que se absorbe se elimina en la orina.

Indicaciones

Tratamiento del acné vulgar.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en casos de hipersensibilidad a la tretinoína. No deberá aplicarse en las mucosas o cerca de ellas, piel eccematosa o en caso de quemaduras. Tampoco deberá usarse simultáneamente con otros agentes queratolíticos. Hay que lavarse las manos después de cada aplicación.

Reacciones adversas

Frecuentes: eritema, irritación, resequedad y descamación de la piel.

Poco frecuentes: hiperpigmentación o hipopigmentación de la piel, así como dermatitis alérgica.

Advertencias para el paciente

Evítese el contacto con la mucosa de ojos, boca y nariz. Se puede presentar una sensación transitoria de calor y ardor en el sitio de aplicación, así como exacerbación temprana del acné durante la primera semana del tratamiento. Hay que informar al médico si las molestias son intensas. Se evitará la exposición a los rayos solares y a la luz ultravioleta.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Tópica en la piel. Aplicar una capa delgada, de preferencia por la noche, durante seis a ocho semanas. Antes de la aplicación deberá lavarse con jabón suave y eliminar el exceso de grasa, y dejar secar la zona durante 15 a 20 minutos.

Presentaciones

ARRETÍN. Crema. Cada 100 g de crema contienen 0.025, 0.05 ó 0.1% de ácido retinoico (tretinoína). Tubo con 30 g de crema al 0.025%. Caja con tubo con 30 g de crema al 0.025, 0.05 ó 0.1%. VALEANT.

ÁCIDO VALPROICO

Antiepilépticos

Propiedades farmacológicas

Ácido simple, sin relación estructural con los antiepilépticos conocidos, con propiedades anticonvulsivas en diversos modelos experimentales y, a nivel clínico, altamente eficaz en el control de las crisis de ausencia y útil en el tratamiento de las crisis mioclonicas, convulsiones tonicoclónicas y en algunos tipos de epilepsia rebeldes al tratamiento convencional. Su efecto anticonvulsivo se logra con concentraciones plasmáticas del orden de 50 a 150 mcg/ml, y se atribuye a que aumenta los niveles de ácido aminobutírico gamma (GABA) en el cerebro al inhibir competitivamente las enzimas que catabolizan este neurotransmisor. Se absorbe rápido y casi por completo por la mucosa gastrointestinal, y alcanza concentraciones plasmáticas máximas en 1 a 4 h. Se une en cantidades importantes a las proteínas plasmáticas (90 a 95%) y se distribuye en el espacio extracelular, alcanzando concentraciones elevadas en el sistema nervioso central. Se metaboliza en el hígado y se elimina en la orina. Alrededor de 15 a 20% se elimina en forma de CO₂ con las espiraciones. Su vida media plasmática es de 8.5 a 15 horas.

Indicaciones

Tratamiento de diversos tipos de epilepsia: crisis generalizadas tonicoclónicas (gran mal), clónicas, ausencias (pequeño mal), ausencias atípicas. Convulsiones febriles.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al ácido valproico, disfunción hepática o antecedentes de enfermedad hepática, discrasias sanguíneas, enfermedad orgánica del sistema nervioso central, insuficiencia renal y durante el embarazo. Aumenta los efectos anticoagulantes del ácido acetilsalicílico y la warfarina, y potencia el efecto de los depresores del sistema nervioso central. Altera las concentraciones séricas de fenitoína. Antes, y periódicamente durante su administración, deben determinarse las concentraciones séricas de transaminasa glutámica oxalacética y glutámica pirúvica, cuya elevación suele ser indicativa de lesión hepática.

Reacciones adversas

Frecuentes: náusea, vómito, diarrea, temblor, aumento de peso, irregularidad del periodo menstrual.

Poco frecuentes: alargamiento del tiempo de coagulación (riesgo de sangrado), trombocitopenia, alopecia parcial y transitoria, anorexia, cefalea, irritabilidad, insomnio, depresión psíquica, alucinaciones, parestesias.

Raras: hepatotoxicidad (ictericia, cansancio, debilidad), pancreatitis, aumento de las crisis convulsivas. En algunos pacientes, la disfunción hepática ha conducido a la muerte; esto ocurre durante los primeros seis meses de tratamiento.

Advertencias para el paciente

No debe discontinuarse abruptamente el tratamiento. No se ingerirán bebidas alcohólicas. Absténgase de manejar vehículos o maquinaria peligrosa. Hay que realizar visitas periódicas para verificar el avance del tratamiento. Si se presentan molestias gastrointestinales, ingiérase junto con alimentos.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. 5 a 15 mg/kg de peso corporal en 24 h, fraccionada en dos o tres tomas; aumentar de 5 a 10 mg/kg/día en intervalos de una semana, hasta obtener la respuesta deseada o hasta que aparezcan efectos adversos. La dosis máxima recomendada es de 60 mg/kg/día.

Niños:

Oral. De uno a 12 años de edad, véase dosis para adultos.

Presentaciones

DEPAKENE. *Cápsulas.* Cada cápsula contiene 250 mg de ácido valproico. Frascos con 30 y 60 cápsulas. *Jarabe.* Cada cucharadita de 5 ml contiene 288 mg de valproato de sodio, equivalentes a 250 mg de ácido valproico. Frasco con 100 ml. **ABBOTT.**

EPIVAL. *Comprimidos.* Cada comprimido con capa entérica contiene valproato semisódico equivalente a 250 ó 500 mg de ácido valproico. Frasco con 30 ó 60 comprimidos de 250 mg. Frasco con 30 comprimidos de 500 mg. **ABBOTT.**

EPIVAL SPRINKLE. *Cápsulas.* Cada cápsula de Epival Sprinkle contiene valproato semisódico equivalente a 125 de ácido valproico. Frascos con 30 cápsulas con partículas recubiertas de 125 mg de de valproato semisódico. **ABBOTT.**

LEPTILÁN. *Grageas.* Cada gragea contiene valproato de sodio equivalente a 130 ó 260 mg de ácido valproico. Caja con 20 grageas de 130 ó 260 mg. **NOVARTIS.**

ADAPALENO

Dermatológico

Propiedades farmacológicas

Fármaco estructuralmente relacionado con el ácido retinoico que actúa como modulador de la diferenciación o de la proliferación celular, la queratinización y el proceso inflamatorio presentes en el acné vulgar. Su acción sobre la epidermis parece depender de su capacidad de unirse a los receptores del ácido retinoico en el núcleo celular y controlar la transcripción de genes. Su aplicación tópica sobre la piel estimula el recambio de células epidérmicas, lo cual facilita su descamación y la expulsión de comedones e inhibe la formación de otros nuevos. También normaliza la queratinización acroinfundibular y disminuye los quistes inflamatorios y las cicatrices presentes en las lesiones del acné vulgar. Su efecto benéfico sobre el acné vulgar es evidente de 8 a 12 semanas después de iniciado el tratamiento. Cuando se aplica sobre la piel, sólo un valor reducido del fármaco (< 5%) se absorbe y pasa a la circulación sistémica. La fracción que se absorbe se elimina a través de la bilis.

Indicaciones

Tratamiento del acné vulgar.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al adapaleno o a alguno de los componentes de la formulación. No se recomienda su aplicación durante el embarazo y la lactancia. Aplíquese con cuidado en pacientes con exantema. Evite la exposición al sol y el contacto con mucosas, ojos, boca y los ángulos de la nariz. Durante el tratamiento se pueden presentar algunas manifestaciones cutáneas, como eritema, resequedad, quemaduras o prurito, en especial durante las primeras 2 a 4 semanas. Aquéllas tienden a disminuir con el uso continuo del fármaco. Puede aumentar el efecto de algunos hepatotóxicos como el metotrexato.

Reacciones adversas

Frecuentes: eritema, ardor, prurito, irritación, piel seca. Durante las primeras semanas pueden exacerbarse las manifestaciones de acné.

Advertencias para el paciente

Evítese el contacto con membranas mucosas, ojos y boca. Se puede presentar una sensación transitoria de ardor y prurito en el sitio de la aplicación. Lávese las manos antes y después de la aplicación. Evite hidratar la piel inmediatamente antes de la aplicación de adapaleno, y lávese la piel únicamente dos o tres veces al día. Informar al médico si se presenta irritación dérmica grave. No debe aplicarse simultáneamente con otras formulaciones dérmicas. Evitar la exposición directa al sol.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Tópica en la piel. Lavar con jabón suave y secar la zona afectada antes de la aplicación del fármaco. Aplicar sobre el área afectada una capa delgada de la formulación al 0.1% antes de acostarse.

Niños:

Mayores de 12 años, ver adultos.

Presentaciones

ADAFERÍN. *Crema*. Cada 100 g contienen 0.1 g de adapaleno. Caja con tubo con 30 g. *Gel*. Cada 100 g contienen 0.1 g de adapaleno. Caja con tubo con 30 g. GALDERMA.

A

ALANTOÍNA Y ALQUITRÁN DE HULLA

Dermatológicos

Propiedades farmacológicas

La alantoína, químicamente denominada glioxildiurea, se obtiene de la consuelda (*Symphytum officinale*) o como producto de la oxidación del ácido úrico. Es un polvo blanco sin efectos irritantes, tóxicos, ni alergénicos que estimula la proliferación celular, mecanismo por el que promueve la cicatrización de las heridas. También tiene efecto antipruriginoso y humectante. El alquitrán de hulla es producto de la destilación del carbón. Se trata de un líquido marrón o negro de elevada viscosidad que huele a naftalina y que está formado por la unión de hidrocarburos aromáticos, bases nitrogenadas y fenoles. En solución, es un antiséptico suave, con propiedades antipruriginosas, astringentes, queratolíticas y fotosensibilizantes. Irrita levemente la piel, efecto que aumenta cuando el sitio de aplicación se expone a la luz solar. Además, el alquitrán de hulla inhibe localmente la síntesis de DNA y, por tanto, la mitosis celular. La combinación alantoína y alquitrán de hulla tiene efectos queratolíticos, ablanda y provoca la caída de las capas córneas patológicas, desintegrando los tapones de queratina que llegan a taponar los poros; además, al inhibir la síntesis de DNA, evita la proliferación de las células epidérmicas que conforman las placas eritematoescamosas de la psoriasis.

Indicaciones

Tratamiento de la psoriasis y algunas dermatitis seborreicas y liquenificadas.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en pacientes hipersensibles a alguno de sus componentes. No aplicar en mucosas y áreas de piel infectada o erosionada. En enfermos con psoriasis exacerbada produce exfoliación generalizada. El uso repetido da lugar a eritema.

Reacciones adversas

Frecuentes: eritema, prurito, ardor, oscurecimiento del cabello.

Poco frecuentes: alergia o dermatitis por contacto, precipitación de dermatitis exfoliativa o psoriasis pustular generalizada, atrofia, telangiectasia, queratoacantomas, hipersensibilidad a la luz solar que se manifiesta con pigmentación.

Advertencias para el paciente

Al iniciar el tratamiento, despréndase las escamas, previo ablandamiento con un baño caliente. Proteja el área tratada de la luz directa del sol por 72 h y asegúrese de retirar la sustancia antes de exponer la piel al sol. Causa irritación de la piel; si esto ocurre, suspéndase su aplicación e informe al médico. En caso de contacto con ojos enjuagar con abundante agua.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Tópica en la piel. Psoriasis, aplique la suspensión sobre la piel afectada, inicialmente dos o tres veces por semana, seguida de dos veces al día hasta por seis semanas, después reducir la dosis a una aplicación semanal. Dermatitis liquenificadas, aplicar pincelaciones de la solución, dos veces al día.

Niños:

Tópica en la piel. Mayores de cinco años, véase adultos.

A

Presentaciones

ANTADERM. *Suspensión dérmica.* Cada 100 ml de suspensión contiene 2.0 g de alantoína, 0.940 g de alquitrán de hulla y vehículo cbp 100 ml. Frasco con 120 ml. DARIER.

ALBENDAZOL

Antihelmínticos

Propiedades farmacológicas

Derivado del benzimidazol, con acción sobre las larvas y las formas adultas de los nematodos gastrointestinales y pulmonares, y sobre las formas adultas de los cestodos y de los trematodos. Sus efectos más significativos se observan en las parasitosis provocadas por *Ascaris lumbricoides*, *Enterobius vermicularis* (oxiuros), *Ancylostoma duodenale*, *Necator americanus*, *Trichuris trichiura* (tricocefalos), *Taenia saginata*, *T. solium* (solitaria), *Hymenolepis nana*, *Strongyloides stercoralis* y *Fasciola hepatica*. Su efecto antiparasitario se atribuye a que inhibe la captura de glucosa en los helmintos susceptibles. Se absorbe bien a través de la mucosa gastrointestinal y alcanza cifras sanguíneas máximas a las 3 h después de su administración. Se distribuye por todo el organismo y la mayor concentración se obtiene en hígado y riñones. Se metaboliza rápidamente en el hígado y se elimina en unos cinco días, la mayor parte en forma de sulfóxido de albendazol. Se elimina 85% en la orina y el resto en las heces.

Indicaciones

Tratamiento de la parasitosis intestinal única o múltiple. En particular, es eficaz en ascariosis, enterobiosis, tricocefalosis, uncinariosis, estrongiloidosis, teniosis.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al albendazol. No debe usarse en niños menores de dos años ni durante el embarazo. No se conoce su interacción con otros medicamentos, por lo que se recomienda precaución a este respecto.

Reacciones adversas

Poco frecuentes: mareo, astenia, cefalea.

Advertencias para el paciente

No ayunar ni tomar laxantes con motivo del tratamiento. Las tabletas pueden ser masticadas, tragadas o trituradas y mezcladas con alimento.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Ascariosis, enterobiosis y uncinariosis: 400 mg en dosis única. Tricocefalosis, teniosis, estrongiloidosis, fasciolosis y en infestaciones graves: 400 mg al día en dosis única, durante tres días consecutivos. Si no se observa mejoría en un lapso de tres semanas, prescribese un segundo tratamiento.

Niños:

Oral. Mayores de dos años, véase dosis del adulto.

Presentaciones

DIGEZANOL. *Tabletas*. Cada tableta contiene 200 mg de albendazol. Caja con dos tabletas de 200 mg. Caja con seis tabletas de 200 mg. *Suspensión*. Cada ml de suspensión contiene 20 mg de albendazol. Frasco con 20 ml con 400 mg. HORMONA.

ZENTEL. *Tabletas*. Cada tableta contiene 200 ó 400 mg de albendazol. Caja con dos, seis o 10 tabletas de 200 mg cada una. Caja con cinco o 10 tabletas de 400 mg. *Suspensión*. Cada 100 ml contienen 4.0 g de albendazol. Frasco de 10 ml o 30 ml (200 mg/5 ml). Caja de cartón con tres o cinco frascos con 10 ml (200 mg/5 ml). GLAXOSMITHKLINE.

A

ALENDRONATO

Antiosteoporósicos

Propiedades farmacológicas

Bisfosfonato nitrogenado análogo de lípidos fosfatados que inhibe la resorción ósea porque actúa sobre los osteoclastos maduros o sobre sus precursores. La inhibición de la velocidad de resorción ósea conduce, de manera indirecta, a la formación de hueso. De manera específica inhibe a la enzima que controla la biosíntesis de lípidos esenciales en el proceso postranscripcional de la proteína GTPasa; la disminución en las concentraciones de este segundo mensajero reduce la actividad osteoclástica de resorción ósea. Su administración repetida reduce la velocidad de formación de nuevas unidades remodeladoras de hueso, lo que conduce a un aumento en la masa ósea después de varios meses de tratamiento. Su efecto benéfico en pacientes con osteoporosis se presenta varias semanas después de iniciado el tratamiento. Su absorción gastrointestinal es limitada y disminuye en presencia de alimentos. Un 50% del fármaco absorbido se une al tejido óseo y el resto se elimina sin cambios en la orina.

Indicaciones

Osteoporosis posmenopáusica. Osteoporosis inducida por glucocorticoides. Enfermedad ósea de Paget.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al alendronato, a los bisfosfonatos o a cualquier componente de la fórmula. También está contraindicado en pacientes con o en riesgo de desarrollar hipocalcemia. La administración de alendronato puede causar o exacerbar disfagia, esofagitis y úlcera esofágica o gástrica. No debe administrarse durante el embarazo y la lactancia. Usar con precaución en pacientes con insuficiencia renal. Evitar la ingesta simultánea de alimentos, antiácidos, fármacos con cationes polivalentes (calcio, magnesio, hierro).

Reacciones adversas

Frecuentes: hipocalcemia moderada y transitoria, hipopotasemia moderada y transitoria.

Poco frecuentes: cefalea, dolor abdominal, dispepsia, náusea, flatulencia, gastritis, estreñimiento, dolor muscular.

Raras: angioedema, úlcera duodenal, reacciones de hipersensibilidad.

Advertencias para el paciente

Tomar el medicamento 1 a 2 h antes de comer o tomar cualquier alimento, bebida o ambos, o cualquier otro fármaco. Tomar el medicamento en ayunas con al menos un vaso grande de agua natural (no mineralizada) y no recostarse durante los siguientes 30 min. Esto disminuye el riesgo de irritación esofágica. Informar al médico si los dolores musculares y articulares son intensos; estas manifestaciones suelen disminuir conforme progresa el tratamiento.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Tratamiento y prevención de la osteoporosis posmenopáusica, 5 a 10 mg diarios en dosis única o 35 a 70 mg una vez a la semana. Tratamiento y prevención de la osteoporosis inducida por glucocorticoides, 5 a 10 mg una vez al día. Enfermedad de Paget, 40 mg una

vez al día durante 6 meses, seguido de un periodo de 6 meses sin tratamiento. En todos los casos tomar de 1 a 2 h antes de los alimentos, bebidas u otros medicamentos.

A

Presentaciones

DRONADRIL. *Tabletas.* Cada tableta contiene alendronato sódico equivalente a 10 ó 70 mg de alendronato. Caja con envase alveolado o de burbuja (*blister pack*) con 30 tabletas de 10 mg. Caja con *blister pack* con 4 tabletas de 70 mg. ALPHARMA.

FOSAMAX. *Tabletas.* Cada tableta contiene alendronato sódico equivalente a 10 ó 70 mg de alendronato. Caja con 15 ó 30 tabletas de 10 mg. Caja con 4 tabletas de 70 mg. MERCK SHARP & DOHME.

ALGESTONA Y ESTRADIOL

Anticonceptivos

Propiedades farmacológicas

Formulación farmacéutica que contiene un progestágeno (acetofénido de algestona) y un estrógeno (enantato de estradiol). La administración intramuscular de esta mezcla favorece su depósito en tejido adiposo, de donde se libera de manera lenta y sostenida manteniendo concentraciones terapéuticas que permiten su administración una vez al mes. Esta mezcla interfiere con la fecundación porque inhibe las secreciones hipofisarias de las hormonas gonadotrópicas, la maduración folicular y suprime en un porcentaje elevado los ciclos ovulatorios. Además, provoca cambios endometriales que interfieren con el proceso de anidación e induce la formación de moco cervical viscoso e impenetrable que interfiere con la migración de los espermatozoides de la vagina a las cavidades uterina y tubaria. El efecto combinado de estas acciones determina su eficacia anticonceptiva que alcanza hasta un 95%. Los principios activos administrados intramuscularmente se distribuyen unidos a proteínas plasmáticas y se fijan al tejido adiposo, de donde se libera gradualmente, logrando ciclos menstruales similares a los fisiológicos. El metabolismo es hepático y su eliminación es a través de la orina para el enantato de estradiol y en las heces para el acetofénido de algestona. El restablecimiento de la función ovárica ocurre en un plazo de tres meses después de la interrupción del tratamiento.

Indicaciones

Prevención del embarazo.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad a los componentes de la formulación, tabaquismo, tromboflebitis, tromboembolia o enfermedad vascular cerebral, carcinoma dependiente de estrógenos, neoplasias hepáticas, hepatitis colestásica, litiasis biliar, sangrado vaginal anormal, hipertensión arterial, insuficiencia cardíaca, diabetes mellitus, depresión mental, migraña, alteración renal, patología tiroidea, patología ósea metabólica, durante el embarazo y la lactancia. Antes del tratamiento, a los tres meses de iniciado éste y después cada seis a 12 semanas, efectuar exploración física, con atención especial a mamas, hígado, órganos pélvicos, presión arterial, pruebas de funcionamiento hepático y Papanicolaou. Diversos fármacos disminuyen la eficacia anticonceptiva de esta mezcla: barbitúricos, carbamazepina, fenilbutazona, primidona, rifampicina, ampicilina, cloranfenicol, isoniazida, neomicina, nitrofurantoína, penicilina V, sulfonamidas y tetraciclinas. En casos de cirugía electiva suspender tres meses antes el uso de este anticonceptivo y, de ser necesario, utilizar anticonceptivos de barrera. En casos de cirugía de urgencia, adminístrese heparina para evitar complicaciones tromboembólicas. Si fracasa la medicación anticonceptiva y se produce un embarazo, deberá suspenderse de inmediato la administración de este anticonceptivo.

Reacciones adversas

Frecuentes: náusea, vómito, cefalea, edema de pies y tobillos, cólicos abdominales.

Poco frecuentes: goteo o sangrado intermenstrual, mastalgia, aumento de peso, irritabilidad, disminución o aumento de la libido.

Raras: episodio tromboembólico, erupción cutánea, ictericia, tumores malignos en el aparato reproductor, tumores hepáticos.

Advertencias para el paciente

Aplicar ocho días después del inicio del ciclo menstrual. Si no es posible aplicar el fármaco el octavo día, debe administrarse antes del décimo para lograr los efectos anticonceptivos deseados. Si no se aplicó antes del décimo día después de iniciado el ciclo menstrual debe suspenderse y administrarse hasta el siguiente ciclo.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Intramuscular profunda. Una jeringa (75 mg de acetofénido de algestona y 5 mg de enantato de estradiol) el día ocho después del inicio del ciclo menstrual.

Presentaciones

ANAFERTIN. *Solución inyectable.* Cada jeringa contiene 75 mg de acetofénido de algestona y 5 mg de enantato de estradiol en 1 ml de agua estéril. Caja con una jeringa prellenada con 1 ml y una aguja estéril. ARMSTRONG.

ALOPURINOL

Antigotosos

Propiedades farmacológicas

Fármaco sintético, análogo estructural de la purina hipoxantina, cuyos efectos farmacológicos son consecuencia de la inhibición que ejerce sobre la oxidasa de las xantinas, igual que la aloxantina, su metabolito primario. Esta acción determina una reducción de las concentraciones plasmáticas y de la excreción urinaria de ácido úrico, y aumento de las concentraciones plasmática y de la excreción renal de las oxipurinas (hipoxantina, xantina), precursores más solubles. La modificación del catabolismo de las purinas explica sus efectos benéficos en la gota, trastorno en el que, al disminuir las concentraciones plasmáticas de ácido úrico hasta cifras inferiores al límite de solubilidad, favorece la disolución de tofos, impidiendo que aparezca o empeore la artritis gotosa aguda. Asimismo, reduce la posibilidad de la formación de cálculos de ácido úrico, lo que impide el desarrollo de nefropatía. No tiene propiedades uricosúricas, antiinflamatorias ni analgésicas. Se absorbe bien en el tubo digestivo y las concentraciones plasmáticas son máximas entre los 30 y 60 min posteriores a su administración oral. Su vida media biológica es de 2 a 3 h, principalmente por conversión metabólica a aloxantina, metabolito activo con una vida media biológica de 18 a 36 h, el cual se acumula en el organismo durante la administración crónica de alopurinol, y contribuye de manera importante a los efectos terapéuticos del medicamento. Tanto el alopurinol como su metabolito principal se distribuyen ampliamente en el organismo, con excepción del cerebro, en el cual la concentración es aproximadamente tres veces menor que la lograda en otros tejidos. Menos de 10% de una dosis única, o 30% del fármaco ingerido en forma crónica, se excreta sin cambios por la orina.

Indicaciones

Tratamiento de la artritis gotosa crónica. Tratamiento y profilaxis de la hiperuricemia. Profilaxis y tratamiento de la nefropatía acidótica.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al alopurinol, durante embarazo y lactancia, insuficiencia renal o hepática. Puede desencadenar ataques agudos de gota durante las etapas iniciales de su administración, lo que hace necesario un tratamiento profiláctico con colchicina. Se recomienda la evaluación periódica de la función hepática y renal, así como la realización de biometrías hemáticas durante el tratamiento. El alopurinol previene el metabolismo de la 6-mercaptopurina y la azatioprina; por ello, la dosis usual del antineoplásico debe reducirse en 25 a 30%. Su administración conjunta con ciclofosfamida da lugar a mayor toxicidad. El alopurinol administrado de manera concomitante con hierro causa hemocromatosis por aumento de la absorción de hierro. Los fármacos uricosúricos aumentan la excreción renal de aloxantina. La ocurrencia de erupción cutánea es mayor al administrar ampicilina con alopurinol en forma simultánea. El alopurinol incrementa los valores plasmáticos de teofilina.

Reacciones adversas

Frecuentes: erupciones pruríticas, eritematosas y maculopapulosas; en ocasiones, la lesión es exfoliativa, urticárica o purpúrica.

Poco frecuentes: náusea, vómito, irritación gástrica, diarrea, somnolencia, vértigo, cefalalgia, fiebre y dolores musculares.

Raras: hepatotoxicidad, síndrome de Stevens-Johnson, leucopenia, leucocitosis, eosinofilia, agranulocitosis, anemia aplásica.

Advertencias para el paciente

Tómese junto con los alimentos y con suficiente cantidad de agua (10 a 12 vasos de agua al día). Se evitará el manejo de maquinaria peligrosa y la conducción de automóviles. Notificar al médico si aparece erupción cutánea.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Control de la gota e hiperuricemia, 100 mg al día e incrementar 100 mg al día a intervalos de una semana, hasta lograr la concentración plasmática deseada de ácido úrico. No se exceda de 800 mg al día. La dosis de mantenimiento es de 100 a 200 mg, dos o tres veces al día. Terapéutica con antineoplásicos, inicial: 600 a 800 mg iniciando dos a tres días antes de los quimioterapéuticos o de la radiación. Después, la dosis depende de las concentraciones plasmáticas de ácido úrico. Cálculos renales de ácido úrico, 100 a 200 mg una a cuatro veces al día.

Niños:

Oral. Hiperuricemia secundaria asociada al tratamiento antineoplásico. Menores de seis años, 50 mg tres veces al día. De seis a 10 años, 100 mg tres veces al día. La respuesta se evalúa a las 24 h de haberse iniciado el tratamiento, y la dosis se ajusta, si es necesario.

Presentaciones

ATISURIL 300. *Tabletas.* Cada tableta contiene 300 mg de alopurinol. Caja con 20 y 50 tabletas. ITALMEX.

ZYLOPRIM 100. *Tabletas.* Cada tableta contiene 100 mg de alopurinol. Caja con 60 tabletas. ZYLOPRIM 300. *Tabletas.* Cada tableta contiene 300 mg de alopurinol. Caja con 30 ó 60 tabletas. GLAXOSMITHKLINE.

ALPROSTADILO

Disfunción eréctil

Propiedades farmacológicas

El alprostadilo es idéntico a la prostaglandina (PGE_1) y produce varios de sus efectos farmacológicos, incluidos vasodilatación, inhibición de la agregación plaquetaria, estimulación del músculo liso intestinal y uterino, reducción de la presión arterial y aumento reflejo de la frecuencia y gasto cardíacos. Además, relaja o dilata los anillos del músculo liso del conducto arterioso de los neonatos; por este efecto se utiliza para incrementar la corriente pulmonar y la oxigenación de la sangre en lactantes con cardiopatías que restringen el torrente pulmonar o sistémico. No está disponible una formulación farmacéutica para este uso. Por otro lado, la inyección intracavernosa de esta prostaglandina ocasiona erección completa o parcial en sujetos impotentes que no muestran trastornos del aparato vascular ni daño en el cuerpo cavernoso. La erección se inicia en 10 min y dura aproximadamente 30 a 60 min. La formulación disponible se administra por vía intracavernosa. La cantidad que se absorbe se une discretamente a las proteínas plasmáticas. No se tiene información sobre su distribución. Se metaboliza con rapidez a su paso por los pulmones, donde se forman diversos productos, que se eliminan en la orina.

Indicaciones

Disfunción eréctil.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en pacientes con tendencia al priapismo.

Reacciones adversas

Frecuentes: dolor en el pene, sensación uretral de quemadura.

Poco frecuentes: sangrado uretral, dolor testicular, hematoma, fibrosis peneana.

Advertencias para el paciente

La primera administración deberá hacerse bajo supervisión médica con el fin de que se determine la dosis apropiada, para demostrar la técnica de administración y para determinar si se produce hipotensión. El uso de este producto requiere vigilancia médica estrecha.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Intracavernosa directa. Disfunción eréctil. La dosis habitual es de 10 a 20 mcg. Sin embargo, se recomienda una titulación inicial de 2 a 3 mcg. La titulación deberá hacerse bajo supervisión médica con el fin de evaluar la respuesta. El paciente debe permanecer en el consultorio hasta que ocurra la destumescencia completa. Los varones con disfunción vasculógena pueden requerir una dosis mayor de 20 mcg. No exceder de 60 microgramos.

Presentaciones

CAVERJECT. *Solución inyectable.* Cada frasco ampula con liofilizado contiene 10 ó 20 mcg de alprostadilo. Cada jeringa con diluyente contiene 9 mg de alcohol bencílico y agua inyectable, 1 ml. Caja con frasco ampula con 10 ó 20 mcg de alprostadilo, jeringa precargada con 1 ml de diluyente, dos agujas y dos torundas. PFIZER.

ALTEPLASA

A

Anticoagulantes y antitrombóticos

Propiedades farmacológicas

La alteplasa, forma recombinante del activador tisular del plasminógeno (t-PA), es una glucoproteína de 65 kDa con propiedades trombolíticas. Su efecto se debe a que activa la conversión de plasminógeno en plasmina, la cual cataliza la degradación de fibrina a fibrinógeno (fibrinólisis) y la disolución del coágulo. La conversión de plasminógeno en plasmina la produce sólo en la superficie de los trombos y émbolos, sin afectar al plasminógeno circulante. A diferencia de la estreptocinasa, ésta no es antigénica y puede ser usada en pacientes en donde la estreptocinasa está contraindicada. Se administra por infusión intravenosa y el principal órgano de eliminación es el hígado. Los niveles plasmáticos se correlacionan con la velocidad de infusión. Su vida media de eliminación es bifásica: una de 5 a 6 min y otra de 64 minutos.

Indicaciones

Tratamiento del infarto agudo miocárdico. Lisis de los trombos de la arteria coronaria. Manejo de la embolia pulmonar aguda. Trombosis arterial y venosa.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en casos de hipersensibilidad a la alteplasa o a cualquiera de los componentes de la formulación, sangrado interno activo, enfermedad vascular cerebral hemorrágica, cirugía o traumatismos intracraneales o intraespinales recientes, neoplasma intracraneal, malformación arteriovenosa o aneurisma, cirrosis y hepatitis activa, hipertensión grave no controlada, durante el embarazo y la lactancia. Debe usarse con precaución en casos de predisposición a sangrado, parto o traumatismo recientes. Los anticoagulantes orales, inhibidores de la agregación plaquetaria y la heparina incrementan el riesgo de hemorragia; mientras que los inhibidores del ECA pueden aumentar el riesgo de sufrir una reacción anafilactoide. Los antifibrinolíticos (ácido aminocaproico y ácido tranexámico) antagonizan su efecto. Debido al riesgo de sangrado sólo deberá ser administrado por especialistas y su uso es exclusivamente intrahospitalario.

Reacciones adversas

Frecuentes: hemorragias gastrointestinal o genitourinaria, sangrado local, arritmias por reperfusión, hipotensión arterial, fiebre, náusea y vómito.

Poco frecuentes: hemorragias internas graves y hematomas.

Raras: reacciones de hipersensibilidad graves, como anafilaxis, edema laríngeo, urticaria.

Advertencias para el paciente

Mantener el reposo en cama y otras medidas adicionales indicadas por el médico para disminuir el riesgo de hemorragia.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Infusión intravenosa. Infarto agudo de miocardio, la dosis recomendada para pacientes con peso corporal mayor de 67 kg es de 100 mg. Régimen de 90 min, comenzando dentro de las primeras 6 h de inicio del infarto con un bolo de 15 mg, seguido de una infusión de 50 mg durante 30 min, y 35 mg durante 60 min. En los pacientes con peso inferior a 67 kg, la dosis

A

recomendada es de un bolo de 15 mg, seguido de una infusión 0.75 mg/kg (sin exceder de 50 mg) durante 30 min; después, infusión de 0.50 mg/kg (sin exceder de 35 mg) durante los siguientes 60 min. Régimen de 3 h. La dosis recomendada es de 100 mg comenzando 6 a 12 h a partir del infarto agudo. Administrar 60 mg durante la primera hora, de los cuales 6 a 10 mg se aplican en forma de bolo intravenoso durante los primeros 1 a 2 min. Durante la segunda hora administrar 20 mg y, finalmente, durante la tercera hora administrar los últimos 20 mg. En los pacientes con peso inferior a 65 kg la dosis recomendada es de 1.25 mg/kg de peso, administrada como antes se indica. Embolia pulmonar, la dosis recomendada es de 100 mg administrados durante 2 h. Trombosis arterial, 1.5 mg/h por infusión a través de catéter intraarterial hasta la lisis del trombo, habitualmente menos de 6 h. En todos los casos preparar la solución como indica el fabricante. Administrarse con precaución en los pacientes de más de 70 años.

Niños:

No se ha establecido su eficacia y seguridad.

Presentaciones

ACTILYSE. *Solución inyectable*. El frasco ampula con liofilizado contiene 50 mg de alteplasa y el frasco ampula con diluyente contiene 50 ml de agua inyectable estéril. Cada envase contiene dos frascos ampula con liofilizado, dos frascos ampula con diluyente y 1 instructivo. BOEHRINGER INGELHEIM PROMECO.

ALUMINIO Y MAGNESIO

A

Antiácidos, antiulcerosos

Propiedades farmacológicas

El gel de hidróxido de aluminio y magnesio es un antiácido local que se presenta en una suspensión coloidal de estas bases débiles. Neutraliza o reduce la acidez gástrica, acción que eleva el pH del contenido estomacal y alivia las manifestaciones de hiperacidez. Además, al aumentar el pH gástrico por arriba de 4, hace que disminuya la actividad proteolítica de la pepsina. El efecto antiácido del gel se ejerce por la eliminación de iones hidrógeno de la secreción ácida gástrica, con formación de agua y sales correspondientes; sin embargo, en el medio alcalino intestinal, el ion hidrógeno se libera nuevamente y el antiácido se regenera hasta convertirse a su estado original. El hidróxido de aluminio es demulcente y forma una capa protectora sobre la mucosa gástrica, en tanto que las sales de aluminio que se forman en este sitio tienen acción astringente y, al llegar al colon, causan estreñimiento; asimismo, los iones de aluminio forman sales insolubles con los iones fosfato a nivel intestinal, lo que determina reducción de las concentraciones plasmáticas del ion fosfato y disminuye la posibilidad de la formación de cálculos de fosfato en las vías urinarias. Por otra parte, el hidróxido de magnesio, al reaccionar con el ácido clorhídrico estomacal, forma cloruro de magnesio que es muy soluble, no se absorbe, y actúa como laxante en el intestino delgado. El estreñimiento que producen los compuestos de aluminio y la acción laxante de las sales de magnesio se contrarrestan al administrar antiácidos que contienen ambos iones, como es el caso del gel de hidróxido de aluminio y magnesio.

Indicaciones

Auxiliar en el tratamiento de la hiperacidez gástrica. Auxiliar en el tratamiento de la hiperacidez asociada a úlcera gástrica y duodenal.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad a alguno de los componentes del gel, insuficiencia renal o pancreática, en pacientes debilitados o con aclorhidria. Los iones libres del antiácido forman complejos insolubles con tetraciclinas; por ello, se reduce la absorción de este antibiótico cuando se administra simultáneamente con el gel. También reduce la absorción gastrointestinal de otros medicamentos, como isoniazida y clorpromacina.

Reacciones adversas

Frecuentes: sabor a yeso, estreñimiento o diarrea.

Poco frecuentes: náusea, vómito, dolor estomacal.

Raras: con dosis elevadas y uso crónico se presenta hipermagnesemia o manifestaciones de disminución de fosfato.

Advertencias para el paciente

Tómese el medicamento entre las comidas y al acostarse.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Una cucharada de la suspensión (15 ml) o una tableta masticable tres a cuatro veces al día.

A**Presentaciones**

MELOX[®] PLUS. *Suspensión*. Cada 100 ml contienen 3.7 g de hidróxido de aluminio, 4.0 g de hidróxido de magnesio y 0.5 g de dimeticona. Frasco con 60, 180 ó 360 ml, sabores menta o cereza. MELOX[®] PLUS D.P. *Tabletas masticables*. Cada tableta masticable contiene 200 mg de gel hidróxido de aluminio desecado y 200 mg de hidróxido de magnesio. Caja con 30 ó 50 tabletas masticables, sabores menta o cereza. SANOFI-AVENTIS.

AMBROXOL

A

Antitusígenos y expectorantes

Propiedades farmacológicas

Es el metabolito activo de la bromexina y, al igual que ésta, actúa sobre las secreciones bronquiales fragmentando y disgregando su organización filamentosa, acción que se manifiesta por aumento de volumen y disminución de la viscosidad del esputo. Este efecto explica su utilidad como expectorante/mucolítico en los procesos broncopulmonares que cursan con aumento de la secreción, viscosidad y adherencia del moco. En estos casos reduce significativamente los accesos de tos, la disnea y aumenta la expectoración. Algunos estudios señalan que este fármaco estimula la síntesis y secreción de surfactante pulmonar y que aumenta las concentraciones de antibióticos en el esputo y moco nasal. Se absorbe satisfactoriamente a través de la mucosa gastrointestinal y alcanza concentraciones plasmáticas máximas en 60 min. Se metaboliza en el hígado, donde se forman glucurónidos, y se elimina en la orina y heces. Su vida media de eliminación es de 22 horas.

Indicaciones

Bronquitis aguda. Bronquitis crónica. Bronquiectasia. Neumonía. En todos los casos, sólo para facilitar la expectoración.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al ambroxol, úlcera péptica y durante el embarazo. Al inicio de su administración produce aumento transitorio de los valores de aminotransferasa.

Reacciones adversas

Poco frecuentes: náusea, vómito, diarrea, cefalea.

Raras: reacciones alérgicas.

Advertencias para el paciente

Eliminense las secreciones para evitar acumulación excesiva. Se evitarán olores que produzcan náusea.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Inicial, 30 mg cada 8 h; después, 30 mg cada 12 h. Cápsulas de liberación controlada, 75 mg cada 24 h. *Intramuscular.* 15 mg cada 8 horas.

Niños:

Oral. Menores de dos años, 7.5 mg de la solución oral cada 12 h; mayores de cinco años, 15 mg cada 8 horas.

Presentaciones

BROXOL. *Tabletas.* Cada tableta contiene 30 mg de clorhidrato de ambroxol. Caja con 20 tabletas. *Solución oral.* Cada 100 ml contienen 300 mg de clorhidrato de ambroxol. Caja frasco con 120 ml y medida dosificadora. *Solución gotas pediátricas.* Cada 100 ml de solución gotas pediátricas contienen 750 mg de clorhidrato de ambroxol. Caja con frasco con 30 ml y gotero calibrado. *Solución inyectable.* Cada ampolleta de 2 ml contiene 15 mg de clorhidrato de ambroxol. Caja con 10 ampolletas. **CARNOT.**

A

MUCOSOLVAN. Comprimidos. Cada comprimido contiene 30 mg de clorhidrato de ambroxol. Caja con 20 comprimidos. *Solución oral*. Cada 100 ml contienen 300 mg de clorhidrato de ambroxol. Caja frasco con 120 ml con vaso dosificador. *Gotas*. Cada 100 ml contienen 750 mg de clorhidrato de ambroxol (1 ml equivale a 30 gotas aproximadamente). Caja con frasco gotero con 30 ml. *Solución inyectable*. Cada ampolleta de 2 ml contiene 15 mg de clorhidrato de ambroxol. Caja con 10 ampolletas. PROMECO.

MUCOSOLVAN RETARD. *Cápsulas de liberación prolongada*. Cada cápsula contiene 75 mg de clorhidrato de ambroxol. Caja con 10 cápsulas. PROMECO.

AMIKACINA

Antimicrobianos

A

Propiedades farmacológicas

Aminoglucósido semisintético, derivado de la kanamicina, aunque de más amplio espectro antimicrobiano y que se caracteriza por su resistencia a las enzimas inactivadoras de aminoglucósidos. Es activo contra casi todos los bacilos aerobios gramnegativos de la comunidad y del hospital, incluidas *Pseudomonas aeruginosa*, y casi todas las cepas de *Serratia* y *Proteus*. Asimismo, es bactericida para casi todas las cepas de *Klebsiella*, *Enterobacter* y *Escherichia coli* resistentes a gentamicina y tobramicina. Son menos susceptibles las cepas de *Acinetobacter*, *Providencia*, *Flavobacter* y *Pseudomonas* que no sean *aeruginosa*. En general, tiene poca actividad contra microorganismos anaerobios y bacterias facultativas en condiciones de anaerobiosis. Su acción contra las bacterias grampositivas es limitada. Aunque está bien establecido que la amikacina, como los demás aminoglucósidos, inhibe la síntesis proteínica bacteriana y disminuye la fidelidad de la traducción del mRNA, este mecanismo no explica su rápida acción bactericida, la cual estaría más ligada al transporte del antibiótico al interior de la membrana citoplásmica y a la rotura de ésta, con la consiguiente salida de iones y moléculas al exterior de la célula bacteriana. Como otros aminoglucósidos, la amikacina casi no se absorbe después de su administración oral, y lo hace rápidamente desde los depósitos intramusculares. En este caso, alcanza una concentración plasmática máxima (20 mcg/ml) en unos 30 min; se distribuye en el volumen del líquido extracelular, encontrándose concentraciones altas en la corteza renal. Atraviesa con dificultad la barrera hematoencefálica y sus concentraciones en el líquido cefalorraquídeo aumentan con las meningitis inflamadas. Alcanza altas concentraciones en orina y líquido sinovial. Se excreta principalmente por el riñón y, en menor proporción, por la bilis.

Indicaciones

Infecciones sistémicas graves producidas por bacilos aerobios gramnegativos susceptibles. Particularmente útil en infecciones nosocomiales graves producidas por microorganismos resistentes a gentamicina y tobramicina.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en casos de hipersensibilidad a los aminoglucósidos, insuficiencia renal, botulismo, miastenia grave, parkinsonismo, durante embarazo y lactancia. Sin embargo, en todos estos casos debe considerarse la relación de riesgo-beneficio. Antes y periódicamente durante su administración, deben evaluarse las funciones renal, vestibular y auditiva. Los ancianos y los recién nacidos son más susceptibles a sus efectos tóxicos. Manténgase un estado de hidratación adecuado a fin de disminuir el riesgo de lesión renal. No se recomienda su administración simultánea con otros medicamentos capaces de afectar la función auditiva (ácido etacrínico, manitol, furosemida) o renal (anfotericina B, vancomicina, cisplatino y ciclosporina, entre otros).

Reacciones adversas

Frecuentes: ototoxicidad (coclear y vestibular), manifestada por zumbidos de oídos, deterioro auditivo, cefalea y vértigo; este último se acompaña de ataxia. Toxicidad renal, manifiesta por aumento o disminución del volumen urinario, anorexia, sed. Estos trastornos ocasionan daño irreversible, por lo que debe valorarse oportunamente la suspensión del antibiótico o el ajuste de la dosis.

Raras: dificultad para respirar, somnolencia, debilidad muscular.

A

Advertencias para el paciente

El uso de este medicamento se restringe al tratamiento de infecciones graves y en casos en que los agentes menos tóxicos no sean eficaces. Se hará del conocimiento del médico cualquier malestar que se presente durante el tratamiento, como zumbidos de oídos, dolor de cabeza, náusea, vómito, dificultad para ponerse de pie o disminución en el volumen de orina.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Intramuscular o infusión intravenosa. 5 mg/kg de peso corporal por día, divididos en dos dosis iguales y administrados a intervalos iguales durante siete a 10 días. Redúzcase la dosis en pacientes con insuficiencia renal. La dosis máxima no excederá de 1.5 g/día. Cuando se administra por venoclisis, se debe utilizar solución salina normal o glucosada a 5% (500 mg en 200 ml o 1.0 g en 500 ml) e infundirse lentamente. No se recomienda su mezcla con otros medicamentos.

Niños:

Intramuscular o infusión intravenosa. Neonatos, inicial: 10 mg/kg de peso corporal; después, 7.5 mg/kg de peso cada 12 h. Niños mayores, véase dosis de adultos. Para venoclisis, se prepara como se indica en adultos (100 mg en 40 ml o 250 mg en 100 ml) y se administra lentamente (30 a 60 min).

Presentaciones

AMIKIN. *Solución inyectable.* Cada ampollita contiene 100, 250, 500 mg o 1.0 g de sulfato de amikacina. Caja con dos ampollitas de 100, 250 ó 500 mg de amikacina en 2 ml. Caja con ampollita de 1 g de amikacina en 4 ml. BRISTOL-MYERS SQUIBB.

AMIODARONA

A

Antiarrítmicos

Propiedades farmacológicas

Antiarrítmico de clase III, fármaco que prolonga la repolarización, útil en el tratamiento de las taquiarritmias supraventriculares y ventriculares. Prolonga la duración del potencial de acción y del periodo refractario de todo el tejido cardíaco (aurículas, ventrículos, nodo AV), sin modificar el potencial de reposo de membrana. Hace que disminuya el ritmo sinusal y la conducción auriculoventricular, prolongando notablemente los intervalos P-R, Q-S y Q-T. En pacientes con síndrome de Wolff-Parkinson-White, la amiodarona retarda la conducción y prolonga el periodo refractario eficaz en las vías de conducción accesorias. Por otro lado, bloquea en forma no competitiva los receptores adrenérgicos alfa y adrenérgicos beta, por lo que se opone a la hiperexcitabilidad y frena la conducción AV. Esta acción le confiere propiedades vasodilatadoras a nivel coronario y periférico y, en consecuencia, capacidad para aumentar el flujo coronario y disminuir la resistencia periférica total. Sin embargo, sólo produce hipotensión en dosis elevadas, y su efecto antianginoso es más o menos similar al de otros agentes. Su elevada toxicidad limita su uso clínico. Su absorción por vía oral es lenta y variable (biodisponibilidad, 50% en promedio), y las concentraciones plasmáticas máximas se obtienen en 3 a 7 h después de una sola dosis; a pesar de ello, su acción se inicia en dos a tres días; por regla, requiere de varias semanas y su efecto dura de semanas a meses. Tiene amplia distribución y selectivamente se deposita en piel, hígado, bazo, pulmones, córnea, músculos y tejido adiposo; cruza la barrera hematoencefálica en 10 a 50% y se une a proteínas plasmáticas en 96%. Se biotransforma en el hígado, sitio en el cual se genera un metabolito activo, la desetilamiodarona, y se separa el yodo de la molécula. Su principal vía de eliminación es la digestiva (biliar) y su eliminación renal es mínima. La vida media de eliminación es bifásica: una de dos y medio a 10 días, y otra de 26 a 107 días.

Indicaciones

Prevención y tratamiento de las arritmias ventriculares, incluidas la fibrilación ventricular recurrente y la taquicardia ventricular recurrente hemodinámicamente inestable. Prevención y tratamiento de las arritmias supraventriculares, taquicardia auricular y supraventricular paroxísticas o permanentes, aleteo auricular recidivante, fibrilación auricular paroxística, extrasístoles auriculares y ventriculares, y síndrome de preexcitación (Wolff-Parkinson-White).

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en casos de hipersensibilidad a la amiodarona, trastornos graves de la conducción del nódulo sinusal (bloqueo sinoauricular, bradicardia sinusal, bloqueo auriculoventricular de segundo y tercer grados), episodios de bradicardia con síncope y colapso vascular, hipotensión grave, en el embarazo. Durante su administración es necesario efectuar revisiones periódicas de las funciones pulmonar y tiroidea, para así determinar oportunamente sus efectos tóxicos; también se recomienda un examen oftalmológico periódico. La amiodarona aumenta el efecto de la digoxina, de los anticoagulantes orales y de otros antiarrítmicos; potencia la acción de los bloqueadores adrenérgicos beta y los antagonistas del calcio.

Reacciones adversas

Frecuentes: náusea, vómito, estreñimiento, anorexia, debilidad, temblores, depresión, insomnio, fatiga, movimientos involuntarios, incoordinación, ataxia, pesadillas, alucinaciones, cefalea, nerviosismo y fotosensibilidad.

A

Poco frecuentes: disminución de la libido, sensación de vértigo, hipotiroidismo, temblores parkinsonianos, fibrosis pulmonar, neumonitis, alveolitis, visión borrosa.

Raras: reacciones alérgicas (erupción cutánea), hepatitis.

Advertencias para el paciente

Seguir exactamente el esquema de dosificación asignado y no suspender el tratamiento, a menos que el médico lo indique. Informar de inmediato al médico si se presenta alguna de las siguientes manifestaciones: dificultad para caminar, temblores, dificultad para respirar, edema de las extremidades, visión borrosa, erupción cutánea, coloración amarilla de la piel. Evítese la exposición a la luz solar y sométase periódicamente a exámenes de córnea y tiroides.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Impregnación: 600 a 1 200 mg/día, divididos en tres tomas durante una a tres semanas, hasta que aparece la respuesta terapéutica; al controlar la arritmia o si se presentan reacciones adversas, se reduce a 200 ó 400 mg/día durante un mes. La dosis de mantenimiento es de aproximadamente 100 a 400 mg/día en una a dos tomas.

Niños:

No se ha establecido su seguridad ni su eficacia.

Presentaciones

BRAXAN. *Tabletas.* Cada tableta contiene 200 mg de clorhidrato de amiodarona. Caja con 20 tabletas de 200 mg. ARMSTRONG.

CORDARONE. *Tabletas.* Cada tableta contiene 200 mg de clorhidrato de amiodarona. Caja con 20 tabletas. SANOFI-AVENTIS.

AMITRIPTILINA

A

Antidepresores

Propiedades farmacológicas

Antidepresor tricíclico que inhibe la recaptura de noradrenalina y serotonina en las terminaciones nerviosas, acción que aumenta la concentración sináptica de estos neurotransmisores y que parece explicar su efecto benéfico en la depresión. Su acción antidepresora completa se observa cuatro a seis semanas después de iniciado el tratamiento. Al igual que otros antidepresores tricíclicos, la amitriptilina inhibe la recaptura de monoaminas porque se une al sitio de unión de la proteína transportadora. No afecta la síntesis de dichas aminas, su almacenamiento en las vesículas sinápticas, ni su liberación. Se postula que la mejoría de los síntomas emocionales refleja esencialmente el aumento en la transmisión serotoninérgica, mientras que la mejoría de los síntomas biológicos resulta de la facilitación de la transmisión adrenérgica. Este tipo de fármacos también afecta las transmisiones colinérgica e histaminérgica. Los efectos anticolinérgicos no contribuyen al efecto terapéutico pero sí son responsables de varias reacciones adversas. Por otro lado, la amitriptilina tiene propiedades analgésicas y es útil en el tratamiento de ciertos tipos de dolor. Es un profiláctico eficaz contra la migraña y efectivo en el tratamiento del dolor neuropático. Se piensa que su efecto analgésico es independiente de su efecto antidepresor. También puede ser utilizado, como fármaco de segunda elección, para el tratamiento de la enuresis nocturna en los niños en los que se ha descartado una patología orgánica. Su mecanismo de acción no está claro, puede resultar de sus acciones anticolinérgicas y antiespasmódicas, así como de su efecto sobre el tipo de sueño y de un posible aumento en la liberación de hormona antidiurética. Se absorbe bien en el tubo digestivo y alcanza concentraciones máximas en 4 h. Se distribuye con amplitud en el organismo, cruza la placenta y también alcanza la leche materna. Se metaboliza en el hígado, donde se produce nortriptilina (metabolito activo) y se elimina en la orina y heces. Su vida media de eliminación es de 9 a 27 horas.

Indicaciones

Depresión asociada a ansiedad. Dolor crónico, dolor neuropático. Profilaxis contra la migraña. Enuresis.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en casos de hipersensibilidad a los antidepresores tricíclicos, en el primer trimestre del embarazo, y durante la administración de inhibidores de la monoaminoxidasa. Descontinuar su administración en caso de cirugía. Como se une en gran proporción a las proteínas plasmáticas, sus efectos tienden a aumentar en presencia de fármacos que compiten por ese sitio de unión (ácido acetilsalicílico, fenilbutazona). Sus efectos sedantes pueden ser aditivos con otros antidepresores. Interactúa con diversos fármacos aumentando sus efectos (anticolinérgicos, anfetaminas, alcohol, otros depresores del sistema nervioso central, carbamazepina, warfarina), por lo que se requiere ajustar la dosis en casos de administración simultánea. Algunos fármacos (carbamazepina, fenobarbital) aumentan el metabolismo de la amitriptilina). Los adultos mayores suelen ser más susceptibles a sus efectos tóxicos. Téngase en cuenta que sus acciones antidepresoras ocurren tres a cuatro semanas después de iniciado el tratamiento, y los pacientes con tendencias suicidas deben someterse a vigilancia estrecha durante ese periodo.

A

Reacciones adversas

No se ha establecido la frecuencia de sus reacciones adversas. Se ha reportado: sedación, fatiga, inquietud, vértigo, insomnio, ansiedad, alteraciones de la memoria, manifestaciones extrapiramidales, convulsiones, hipotensión ortostática, taquicardia, urticaria, fotosensibilidad, aumento de peso, sequedad de las mucosas, constipación, retención urinaria, visión borrosa, midriasis, diaforesis.

Advertencias para el paciente

Durante el tratamiento no debe ingerirse alcohol u otros depresores del sistema nervioso central. No se discontinuará la terapéutica sin consultar al médico. La suspensión abrupta puede causar náusea, cefalea y malestar general. Puede causar somnolencia por lo que no habrá de llevarse a cabo tareas peligrosas que requieran de alerta total.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Depresión. 50 a 150 mg en dosis única antes de dormir; también se puede administrar en dosis divididas. La dosis máxima recomendada es de 300 mg al día. Dolor neuropático. Inicial, 10 a 25 mg antes de acostarse, la cual se puede aumentar hasta 75 miligramos.

Niños:

Oral. Dolor crónico. De seis a 12 años de edad, 10 a 30 mg. Adolescentes, 10 mg tres veces al día o 20 mg antes de acostarse. Enuresis. Niños hasta los seis años de edad, 10 mg al día como dosis única antes de acostarse. Mayores de seis años, 10 mg como dosis única antes de acostarse, la cual se puede aumentar hasta un máximo de 25 miligramos.

Ancianos.

Oral. Depresión. 25 mg antes de acostarse. Se puede aumentar hasta 10 mg tres veces al día y 20 mg antes de acostarse.

Presentaciones

ANAPSIQUE. Tabletas. Cada tableta contiene 25 ó 50 mg de clorhidrato de amitriptilina. Excipiente, cbp 1 tableta. Caja con 20 ó 50 tabletas de 25 mg. Caja con 20 tabletas de 50 mg. PSICOFARMA.

TRIPTANOL. Tabletas. Cada tableta contiene 25 mg de clorhidrato de amitriptilina. Caja con 50 tabletas de 25 mg. MERCK SHARP and DOHME.

AMLODIPINA

A

Antianginosos • Antihipertensores

Propiedades farmacológicas

Pertenece al grupo de los antagonistas de los canales del calcio y tiene propiedades antianginosas y antihipertensoras. La amlodipina inhibe el flujo transmembranario de los iones de calcio debido a que se une de manera alostérica a la subunidad α_1 de los canales del calcio tipo L, previniendo su apertura; acción que da como resultado una reducción en la entrada de calcio, lo que modifica la contractilidad del músculo cardíaco y del músculo liso dependiente del movimiento de los iones de calcio extracelulares de las células cardíacas o musculares a través de canales específicos. Esta acción farmacológica disminuye la contractilidad cardíaca y la demanda de oxígeno. Como un vasodilatador arterial periférico, actúa directamente en el músculo liso vascular reduciendo la resistencia vascular periférica y la presión arterial. También dilata las arterias y arteriolas coronarias. Se absorbe por vía oral en un 64 a 90%. Se une a proteínas plasmáticas en un 93% en pacientes hipertensos. Se metaboliza en el hígado por el CYP3A4 y un 90% se convierte en metabolitos inactivos. Se excreta por orina principalmente. Por vía oral alcanza picos plasmáticos entre 6 y 12 h y tiene una duración de acción de 24 horas.

Indicaciones

Angina crónica estable y angina vasoespástica (angina de Prinzmetal o angina variante). Hipertensión arterial.

Contraindicaciones y precauciones

Hipersensibilidad al medicamento. Se deberá administrar con precaución en pacientes que estén recibiendo otros dilatadores periféricos y en aquellos con estenosis aórtica, insuficiencia cardíaca o enfermedad hepática grave. La ingesta concomitante con jugo de toronja puede incrementar los niveles plasmáticos de la amlodipina, aumentando sus efectos farmacológicos y sus reacciones adversas.

Reacciones adversas

Frecuentes: mareo, enrojecimiento, cefalea, hipotensión, edema periférico, taquicardia, palpitaciones.

Poco frecuentes: náusea, dolor abdominal, aumento de la frecuencia de micción, fatiga, somnolencia, parestesias, depresión, dolor de ojos, dolor muscular, disnea, erupciones cutáneas y prurito.

Raras: incremento paradójico del dolor torácico isquémico, descenso excesivo de la presión arterial, lo que puede provocar isquemia cerebral o miocárdica o ceguera transitoria.

Advertencias para el paciente

Infórmese de inmediato al médico en caso de ataques agudos de angina, y continuar con su terapia con nitroglicerina; asimismo, informarle si se presenta cualquier signo de problemas cardíacos, sudación de las manos o de los pies, disminución de la respiración. No suspender el tratamiento si no tiene indicaciones de su médico. No tomar este medicamento con jugo de toronja.

A

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Angina crónica estable, inicialmente 5 ó 10 mg una vez al día; hipertensión arterial, iniciar con 2.5 a 5 mg por vía oral, una vez al día. Ajustar la dosis cada siete a 14 días basado en la respuesta del paciente y en su tolerancia. Dosis máxima de 10 mg diarios.

Ancianos:

Oral. 2.5 mg una vez al día.

Presentaciones

AVISTAR. Tabletas. Cada tableta contiene besilato de amlodipina equivalente a 5 mg de amlodipina. Caja con 10, 30 ó 60 tabletas. *WERMAR.*

ORALCAM. Tabletas. Cada tableta contiene camsilato de amlodipina equivalente a 5 mg de amlodipina. Caja con 10 ó 30 tabletas. *LANDSTEINER.*

AMLIBON. Tabletas. Cada tableta contiene mesilato de amlodipina equivalente a 5 ó 10 mg de amlodipina. Caja con 10 ó 30 tabletas. *SANDOZ.*

AMOROLFINA

A

Antimicóticos

Propiedades farmacológicas

Antimicótico del grupo de las morfolinas eficaz contra numerosas micosis superficiales. Su espectro de acción cubre muchos de los hongos de importancia médica, incluidos: dermatofitos (*Trichophyton*, *Microsporum* y *Epidermophyton*), levaduras (*Candida*, *Malassezia*, *Pityrosporum* y *Cryptococcus*), mohos (*Alternaria*, *Scytalidium*, *Scopulariopsis*, *Hendersonula* y *Aspergillus*), dematiaceas (*Cladosporium*, *Fonsecaea* y *Wangiella*) y hongos dimórficos (*Coccidioides*, *Histoplasma* y *Sporothrix*). Su efecto fungicida depende de su capacidad de inhibir la acción de las enzimas delta-14-reductasa y delta-7,8-isomerasa, las cuales son necesarias para la síntesis del ergosterol, principal componente funcional y estructural de la membrana de los hongos y levaduras. La inhibición de la síntesis del ergosterol induce alteraciones en la permeabilidad membranaria y pérdida de los elementos intracelulares esenciales, inhibiendo el crecimiento del hongo e induciendo su muerte. Se aplica directo sobre las uñas y la piel infectada por lo que no se absorbe. No se administra por vía sistémica.

Indicaciones

Tratamiento de onicomycosis y de diversas micosis superficiales que incluyen: pie de atleta, tiña inguinal, tiña corporis, tiña de las manos, candidosis cutánea y tiña versicolor.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad a la amorolfina. Los antimicóticos sistémicos como cetoconazol, itraconazol, terbinafina y griseofulvina incrementan su efecto.

Reacciones adversas

No se tiene información sobre la frecuencia de las reacciones adversas. Se ha reportado: eritema, prurito, sensación de quemadura y, en pocas ocasiones, reacciones dérmicas graves.

Advertencias para el paciente

Lavar y secar la zona afectada antes de la aplicación del medicamento. No debe discontinuarse o interrumpirse el tratamiento ya que puede ocasionar recurrencia de la infección. Evitar la aplicación de esmalte de uñas y uñas artificiales durante el tratamiento. Las uñas sanas no deben limarse nunca con la lima utilizada para las uñas infectadas. En pacientes que trabajan habitualmente con solventes orgánicos, se deben proteger las manos con guantes impermeables.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Tópica en piel y uñas. Micosis superficiales, aplicar la crema en la zona infectada una vez al día durante tres o cuatro semanas. Onicomycosis, aplicar la solución sobre las uñas infectadas, dos veces al día durante seis meses en las uñas de las manos y durante 12 meses en las uñas de los pies.

Niños:

No se han establecido las dosis pediátricas.

A**Presentaciones**

LOCERYL. *Crema*. Cada mililitro de crema contiene clorhidrato de amorolfina equivalente a 0.25 g de amorolfina. Caja con tubo con 20 g. *Solución*. Cada mililitro de solución contiene clorhidrato de amorolfina equivalente a 50 mg de amorolfina. Caja con frasco de 2.5 ml de solución al 5%, 16 toallitas húmedas en sobres individuales, 10 espátulas y 15 limas desechables. GALDERMA.

AMOXICILINA

Antimicrobianos

A

Propiedades farmacológicas

Penicilina semisintética con propiedades bactericidas. Como otras penicilinas, se une covalentemente a las proteínas fijadoras de penicilina y evitan la transpeptidación, paso final en la síntesis de la pared bacteriana. Finalmente, las bacterias se lisan debido a la exposición de la membrana bacteriana a medios osmóticamente menos estables y a la actividad continua de las enzimas autolíticas (autolisina e hidrolasas de mureína). Su espectro útil, similar al de ampicilina, incluye microorganismos grampositivos como *Enterococcus*, *Staphylococcus*, *Streptococcus*, incluido *S. pneumoniae*, y algunos gramnegativos (*Neisseria*, *E. coli*, *H. influenzae*, *H. pylori*, *Proteus*). Su eficacia ha disminuido contra *H. influenzae*, gramnegativos entéricos y demás microorganismos productores de betalactamasa. Se administra vía oral, tiene excelente biodisponibilidad, no guarda relación con comidas, y su concentración plasmática pico se presenta en 2 h. Se une parcialmente a proteínas del plasma. Se distribuye ampliamente en el organismo y alcanza concentraciones importantes en secreciones broncopulmonares, oído medio, bilis, próstata, tejido óseo y ojo. Cruza la placenta y se secreta en la leche. Eliminación renal de 50 a 70%; su vida media de eliminación en adultos con función renal normal es de 1 a 2 horas.

Indicaciones

De elección en la otitis media aguda, sinusitis e infecciones causadas por microorganismos susceptibles en el tracto respiratorio, piel y tracto urinario. Profilaxis de endocarditis bacteriana (previa a procedimientos dentales, abdominales o ginecológicos) y en la terapia combinada para erradicar a *Helicobacter pylori*.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad a penicilinas o cefalosporinas, asma, insuficiencia renal grave. Las reacciones alérgicas leves se tratan con antihistamínicos y, de ser necesario, con dexametasona. Las reacciones graves con adrenalina (1:1 000), aminofilina, oxígeno, esteroides intravenosos y, en ocasiones, intubación. Precaución en casos de mononucleosis, por mayor riesgo de alergia, y fenilcetonuria, ya que algunas presentaciones contienen fenilalanina. Al igual que otros antibacterianos, puede producir colitis pseudomembranosa. Ajustar la dosis en pacientes con disfunción renal. Algunos antibióticos, como cloranfenicol y tetraciclinas, pueden disminuir su eficacia. Disminuye la eficacia de anticonceptivos orales y de la vacuna contra *Salmonella typhi* e incrementa el efecto de los anticoagulantes orales. El probenecid prolonga las concentraciones séricas de amoxicilina. Falsa positiva de glucosa en orina.

Reacciones adversas

Frecuentes: molestias gastrointestinales como diarrea, dolor abdominal.

Poco frecuentes: reacciones alérgicas leves (salpullido, prurito, otras).

Poco frecuentes: reacciones alérgicas graves (anafilaxis, angioedema, broncoespasmo), colitis pseudomembranosa.

Advertencias para el paciente

No abandonar el tratamiento. Informar de inmediato al médico en caso de diarrea o manifestaciones de alergia como prurito, salpullido, edema de cara o manos, disnea. Puede

mezclar la suspensión con leche, jugo o agua. Almacenar la suspensión en el refrigerador. Suspender en caso de alergia.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. En general, la dosis promedio es 250 a 500 mg cada 8 h o 500 a 875 mg dos veces al día. La dosis máxima es de 2 a 3 g al día. Otitis media, 1 g cada 8 h, por siete días. Casos graves o ante sospecha de *S. pneumoniae* resistente, 80 mg/kg/día por siete días. Profilaxis de endocarditis bacteriana, 2 g, 1 h antes del procedimiento. Terapia combinada con claritromicina y lanzoprazol para erradicar a *H. pylori*, 1 g cada 12 h por 14 días.

Niños:

Oral. En general, la dosis promedio es 20 a 50 mg/kg/día en dosis divididas cada 8 h. Otitis media, 80 mg/kg/día, dividido en dos tomas, por 10 días en niños menores de dos años y por siete días en niños mayores. Niños con baja probabilidad de *S. pneumoniae* resistente, 40 a 45 mg/kg/día, dividido en dos tomas por siete a 10 días. Profilaxis de endocarditis bacteriana, 50 mg/kg, 1 h antes del procedimiento.

Presentaciones

AMOXIL. *Tabletas.* Cada tableta contiene amoxicilina trihidratada equivalente a 875 mg o 1 g de amoxicilina. Caja con 10 tabletas de 875 mg. Caja con 12 tabletas de 1 g. *Cápsulas.* Cada cápsula contiene amoxicilina trihidratada equivalente a 500 mg de amoxicilina. Cajas con nueve, 12 ó 16 cápsulas. *Suspensión.* Cada 5 ml de suspensión contienen amoxicilina trihidratada equivalente a 250 ó 500 mg de amoxicilina. Caja con frasco con polvo para preparar 75 ml de suspensión. GLAXOSMITHKLINE.

AMOXICILINA Y CLAVULANATO

A

Antimicrobianos

Propiedades farmacológicas

La amoxicilina es una penicilina semisintética de amplio espectro con propiedades bactericidas semejantes a las de la ampicilina. Actúa sobre algunas bacterias grampositivas (especies de *Streptococcus*, especies de *Neisseria*) y sobre algunos microorganismos gramnegativos, como *Haemophilus influenzae*, *Escherichia coli* y *Proteus mirabilis*. Es susceptible a la acción de las lactamasas beta. Su efecto antibacteriano se produce porque impide la síntesis de la pared bacteriana al inhibir la transpeptidasa, enzima de la membrana bacteriana. Esta acción impide el entrecruzamiento de las cadenas de peptidoglucano, las cuales dan fuerza y rigidez a la pared celular. También bloquea la división y el crecimiento celular, y con frecuencia se produce alargamiento y lisis en las bacterias susceptibles. El clavulanato tiene efecto bactericida débil y no afecta el mecanismo de acción de la amoxicilina; sin embargo, evita su inactivación porque se une de manera irreversible a las lactamasas beta, lo que protege a la amoxicilina de la degradación enzimática. Los componentes de la mezcla se absorben rápida y casi completamente a través de la mucosa gastrointestinal y alcanzan concentraciones plasmáticas máximas en 1 a 2 h después de su administración. Se unen en forma discreta a las proteínas plasmáticas, se distribuyen ampliamente en el organismo y alcanzan concentraciones importantes en secreciones broncopulmonares, oído medio, bilis, tejido óseo y ojos; sus concentraciones en el líquido cefalorraquídeo son muy discretas. También cruzan la barrera placentaria. Se biotransforman parcialmente en el hígado y se eliminan en la orina. Su vida media es de 1 a 1.3 horas.

Indicaciones

Infecciones de las vías urinarias. Otitis media y sinusitis. Infecciones de las vías respiratorias superiores e inferiores. Infecciones de las vías biliares. Infecciones de la piel y tejidos blandos. En todos los casos, causadas por microorganismos gramnegativos susceptibles.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en pacientes con antecedentes de hipersensibilidad a cualquier componente de la mezcla, asma, fiebre del heno, mononucleosis infecciosa, insuficiencia renal grave. Algunos medicamentos, como cloranfenicol, eritromicina, sulfonamidas y tetraciclinas, interfieren con su efecto bactericida. Disminuye el efecto de los anticonceptivos orales. No se recomienda su administración prolongada, ya que se presentan infecciones agregadas.

Reacciones adversas

Frecuentes: náusea, vómito, diarrea, candidosis oral.

Poco frecuentes: reacciones alérgicas leves (prurito, erupción cutánea).

Raras: reacciones alérgicas graves (anafilaxis, enfermedad sérica, angioedema, broncoespasmo), neutropenia, nefritis intersticial, colitis pseudomembranosa. Con dosis altas y administración intravenosa ocurren convulsiones.

Advertencias para el paciente

Aplicar el tratamiento según la dosis y el tiempo señalado por el médico. Informar de inmediato al médico en caso de que ocurra prurito, erupción cutánea, diarrea intensa.

A

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Neumonía, infecciones graves. 250 a 500 mg cada 8 h (basados en la cantidad de amoxicilina de la mezcla).

Niños:

Oral. Otitis media aguda, sinusitis, neumonía y otras infecciones graves. Menores de 40 kg de peso, 13.3 mg/kg de peso cada 8 h (basados en la cantidad de amoxicilina de la formulación) durante siete a 10 días. Otras infecciones, 6.7 mg/kg de peso cada 8 h (basados en la cantidad de amoxicilina de la formulación) durante siete a 10 días.

Presentaciones

AUGMENTIN. Tabletas. Cada tableta contiene amoxicilina trihidratada equivalente a 500 mg de amoxicilina y clavulanato de potasio equivalente a 125 mg de ácido clavulánico. Caja de cartón con frasco con 10 ó 15 tabletas. GLAXOSMITHKLINE.

AUGMENTIN. Suspensión pediátrica. Cada 5 ml contienen amoxicilina trihidratada equivalente a 125 mg/5 ml de amoxicilina y clavulanato de potasio equivalente a 31.25 mg/5 ml de ácido clavulánico. Caja de cartón con frasco con polvo para reconstituir hasta formar 60 ml de suspensión con pipeta dosificadora. GLAXOSMITHKLINE.

AUGMENTIN. Suspensión junior. Cada 5 ml contienen amoxicilina trihidratada equivalente a 250 mg de amoxicilina y clavulanato de potasio equivalente a 62.5 mg de ácido clavulánico. Caja de cartón con frasco con polvo para reconstituir a 75 ml con cucharita dosificadora. GLAXOSMITHKLINE.

AMPICILINA

A

Antimicrobianos

Propiedades farmacológicas

Antibiótico bactericida de amplio espectro, particularmente eficaz contra algunos microorganismos gramnegativos (*Haemophilus influenzae*, *Salmonella typhi*, *Escherichia coli* y especies de *Shigella*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Proteus mirabilis*) y, en general, menos potente que la benzilpenicilina contra grampositivos. Su efecto se atribuye a que se une e inactiva a la transpeptidasa, acción que evita el entrecruzamiento de las cadenas de peptidoglucano, que le dan fuerza y rigidez a la pared bacteriana. También inhibe la reproducción y crecimiento, y provoca alargamiento y lisis de las bacterias susceptibles. Es destruida por las lactamasas beta (penicilinasas) producidas por bacterias grampositivas y gramnegativas. La ampicilina es estable en el medio ácido gástrico y se absorbe bien por la mucosa gastrointestinal, aun cuando los alimentos retardan su absorción. Por vía oral alcanza concentraciones máximas (3 mcg/ml) en 2 h y por vía intramuscular en 1 h. Tiene una vida media de 1 a 2 h, y se distribuye ampliamente en el organismo, pero sólo cruza la barrera hematoencefálica cuando las meninges están inflamadas. Se une 20% a las proteínas plasmáticas. Se metaboliza parcialmente en el hígado y 30% se elimina sin cambios por la orina y un poco menos por la bilis y la leche materna.

Indicaciones

Infecciones graves por microorganismos susceptibles, en especial cepas de *Haemophilus*, *Salmonella*, *Escherichia*, *Shigella*, *Proteus* y *Neisseria*.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en pacientes alérgicos a las penicilinas o a las cefalosporinas, en pacientes con antecedentes de enfermedades alérgicas (asma, eccema, fiebre del heno), mononucleosis infecciosa, insuficiencia renal grave. La alergia se presenta en personas sin administración previa del antibiótico y no depende de la dosis. Las reacciones leves a moderadas se tratan con antihistamínicos y, si es necesario, con aminas presoras y corticoesteroides. Las reacciones anafilactoides graves requieren medidas de urgencia, como el uso de adrenalina (1:1 000), aminofilina, oxígeno, corticoesteroides intravenosos y control de vías aéreas, incluida la intubación. Las tetraciclinas interfieren con su efecto bactericida. La ampicilina hace que disminuya la eficacia de los anticonceptivos que contienen estrógenos. En los tratamientos prolongados, se evalúan periódicamente los sistemas renal, hepático y hematopoyético. En el recién nacido y en prematuros, la eliminación del fármaco es muy lenta. Durante su administración se presentan superinfecciones por hongos o por microorganismos no susceptibles.

Reacciones adversas

Frecuentes: náusea, vómito, diarrea y, con la administración prolongada, superinfecciones por microorganismos no susceptibles, especialmente candidosis bucal.

Poco frecuentes: reacciones de hipersensibilidad leves (prurito, urticaria, edema, etc.).

Raras: reacciones alérgicas graves (anafilaxis, enfermedad sérica), nefritis intersticial, colitis pseudomembranosa, neutropenia.

Advertencias para el paciente

Se informará al médico de cualquier antecedente de tipo alérgico. Tómese el medicamento 1 h antes o 2 h después de los alimentos. Infórmese de inmediato al médico si hay comezón, ronchas o diarrea grave.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. 250 a 500 mg cada 6 h. En infecciones graves se administran hasta 6 g en 24 h. *Gonorrrea*, 3,5 g como dosis única y 1 g de probenecid. *Intramuscular, intravenosa directa, venoclisis.* 250 a 500 mg cada 6 h. *Gonorrrea*, 500 mg cada 12 h, con dosis únicas. *Meningitis bacteriana, septicemia*, 150 a 200 mg/kg/día en dosis divididas por igual cada 3 a 4 h. *Nota:* las inyecciones intramusculares e intravenosas se administrarán antes de 1 h después de su preparación. La administración intravenosa puede ser directa; disuélvase como lo indica el fabricante y adminístrese muy lentamente. Para infusión intravenosa, reconstituir antes de diluirla en la solución intravenosa.

Niños:

Oral. Hasta 20 kg de peso corporal, 12,5 a 25 mg/kg cada 6 h. En infecciones graves se aumenta hasta 200 mg/kg de peso/día, divididos en cuatro dosis iguales. *Intramuscular o intravenosa.* Hasta 20 kg de peso corporal, 6,25 a 25 mg/kg de peso cada 6 h. *Meningitis bacteriana, septicemia*, 150 a 200 mg/kg/día en dosis divididas por igual cada 3 a 4 h. Para la preparación y administración de las soluciones parenterales, véase la administración en adultos.

Presentaciones

FLAMICINA. *Cápsulas.* Cada cápsula contiene ampicilina trihidratada equivalente a 250 ó 500 mg de ampicilina. Caja con 12 ó 20 cápsulas de 250 mg. Caja con 12, 16 ó 20 cápsulas de 500 mg. Caja con frasco de vidrio con 21 cápsulas de 500 mg. *Tabletas.* Cada tableta contiene 500 mg de ampicilina anhidra. Caja con 8, 12 ó 20 tabletas de 500 mg. *Suspensión.* Cada 5 ml de la suspensión contiene ampicilina trihidratada equivalente a 125 ó 250 mg de ampicilina. Caja de cartón con frasco con polvo para 60 ml (125 mg/5 ml) con vaso dosificador de 5 ml. Caja de cartón con frasco con polvo para 60 ml (250 mg/5 ml) con vaso dosificador de 5 ml. *Solución inyectable.* Cada frasco ampula contiene ampicilina sódica equivalente a 500 mg o 1 g de ampicilina. Caja de cartón con frasco ampula de 500 mg o 1 g y ampolletas de vidrio o plástico con 2 ó 4 ml de diluyente, respectivamente. **IVAX.**

PENBRITIN. *Tabletas.* Cada tableta contiene ampicilina trihidratada equivalente a 1 g de ampicilina. Caja con 12 tabletas de 1 g en envase de celopolial. *Cápsulas.* Cada cápsula contiene ampicilina trihidratada equivalente a 250 ó 500 mg de ampicilina. Caja con 20 cápsulas de 250 ó 500 mg en envase de burbuja. *Suspensión.* Cada 5 ml de suspensión contienen ampicilina trihidratada equivalente a 250 mg de ampicilina. Caja con frasco para 100 ml de suspensión de 250 mg/5 ml y dosificador. *Solución inyectable.* Cada frasco ampula con polvo contiene ampicilina sódica equivalente a 500 mg o 1 g de ampicilina. Cada ampolleta con diluyente contiene 2 ó 4 ml de agua inyectable. Caja con frasco ampula con 1 g y 4 ml de solución inyectable. Caja con 3 frascos ampula con 1 g y 3 ampolletas con solución inyectable, 4 ml. Caja con frasco ampula con 500 mg y solución inyectable 2 ml. Caja con 3 frascos ampula con 500 mg y 3 ampolletas con solución inyectable, 2 ml. **HORMONA.**

PENTREXYL. *Cápsulas.* Cada cápsula contiene ampicilina trihidratada equivalente a 250 ó 500 mg de ampicilina. Caja con 20 cápsulas de 250 ó 500 mg. *Gotas.* Hecha la mezcla, cada ml contiene ampicilina trihidratada equivalente a 100 mg de ampicilina. Caja con frasco con 20 ml (100 mg/ml). *Tabletas.* Cada tableta contiene ampicilina trihidratada equivalente a 1 g de ampicilina. Caja con 10 tabletas de 1 g. *Suspensión.* Hecha la mezcla, cada 100 ml contienen ampicilina trihidratada equivalente a 2,5, ó 5,0 ó 10 g de ampicilina. Caja con frasco con 90 ml de suspensión con 125, 250 ó 500 mg de ampicilina por cada 5 ml. *Solución inyectable.* Cada frasco ampula con polvo contiene ampicilina sódica equivalente a 125, 250, 500 mg o 1 g de ampicilina. Cada ampolleta contiene 2 ó 3 ml de agua inyectable. Caja con

tres frascos ampula con polvo de 125 mg/2 ml, 250 mg/2 ml, 500 mg/2 ml o 1 g/3 ml. Caja con un frasco ampula de 250 mg/2 ml, 500 mg/2 ml, 1 g/3 ml. Todas con diluyente. BRISTOL-MYERS SQUIBB.

A

AMPICILINA Y SULBACTAM

Antimicrobianos

Propiedades farmacológicas

La ampicilina es un antibiótico bactericida de amplio espectro, particularmente eficaz contra algunos microorganismos gramnegativos (*Haemophilus influenzae*, *Salmonella typhi*, *Escherichia coli* y especies de *Shigella*, *Neisseria gonorrhoeae*, *Proteus mirabilis*) y, en general, menos potente que la benzilpenicilina contra grampositivos. Su efecto se atribuye a que se une e inactiva a la transpeptidasa, acción que evita el entrecruzamiento de las cadenas de peptidoglucano que le dan fuerza y rigidez a la pared bacteriana. También inhibe la reproducción y crecimiento, y provoca alargamiento y lisis de las bacterias susceptibles. Es destruida por las lactamasas beta (penicilinasas) producidas por bacterias grampositivas y gramnegativas. El sulbactam actúa como inhibidor irreversible de las lactamasas beta bacterianas, lo que protege a la ampicilina de la degradación enzimática. En el ámbito comercial, la ampicilina se presenta como sultamicilina que es un profármaco de ampicilina (ampicilina tetrahidratada) y el inhibidor de betalactamasas sulbactam; consiste de dos fármacos unidos por un doble éster, el cual durante la absorción es hidrolizado liberando cantidades equimolares de ampicilina y sulbactam. La mezcla se administra por vía oral y ambos fármacos se unen de manera moderada a las proteínas plasmáticas y se distribuyen ampliamente en el organismo, alcanzando diversos tejidos, líquidos corporales y secreciones. La ampicilina cruza la barrera placentaria. Ambos fármacos se metabolizan en forma parcial en el hígado y se eliminan en la orina. Su vida media de eliminación es de 60 a 90 min; en los pacientes con daño renal se prolonga hasta por 24 horas.

Indicaciones

Infecciones graves por microorganismos susceptibles a la ampicilina, en especial cepas productoras de lactamasas beta: intraabdominales (*Escherichia coli*, especies de *Klebsiella* y *Bacteroides*), piel y tejidos blandos (*Acinetobacter calcoaceticus*, *B. fragilis*, *E. coli*, especies de *Klebsiella*, *Proteus mirabilis*, *Staphylococcus aureus*), genitourinarias (*E. coli*, *B. fragilis*, especies de bacteroides).

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en pacientes alérgicos a las penicilinas o a las cefalosporinas, en pacientes con antecedentes de enfermedades alérgicas (asma, eccema, fiebre del heno), mononucleosis infecciosa, insuficiencia renal grave. La alergia se presenta en personas sin administración previa del antibiótico y no depende de la dosis. Las reacciones leves a moderadas se tratan con antihistamínicos y, si es necesario, con aminas presoras y corticoesteroides. Las reacciones anafilactoides graves requieren de medidas de urgencia, como el uso de adrenalina (1:1 000), aminofilina, oxígeno, corticoesteroides intravenosos y control de vías aéreas, incluida intubación. Las tetraciclinas interfieren con su efecto bactericida y el probenecid disminuye la excreción de ampicilina y sulbactam. La ampicilina hace que disminuya la eficacia de los anticonceptivos que contienen estrógenos. En los tratamientos prolongados se evalúan periódicamente los sistemas renal, hepático y hematopoyético. Durante su administración se presentan superinfecciones por hongos o por microorganismos no susceptibles.

Reacciones adversas

Frecuentes: náusea, vómito, diarrea y, con la administración prolongada, superinfecciones por hongos o por microorganismos no susceptibles, especialmente candidosis bucal o vaginal.

Poco frecuentes: reacciones de hipersensibilidad, desde leves hasta graves.
Raras: leucopenia, neutropenia, colitis grave, convulsiones.

A

Advertencias para el paciente

Se informará al médico de cualquier antecedente de tipo alérgico. Infórmese de inmediato al médico si se presenta comezón, ronchas o dificultad respiratoria.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Una o dos tabletas dos veces al día. El tratamiento debe continuarse hasta 48 h después de haber cedido la hipertermia y que otros signos anormales hayan o desaparecido. El tratamiento normalmente se administra de cinco a 14 días.

Niños:

Oral. No se han establecido las dosis para menores de 12 años. Mayores de 12 años, véase la dosis de adultos.

Ancianos:

Oral. Ver dosis de adultos.

Presentaciones

UNASYNA. *Tabletas.* Cada tableta contiene tosilato de sultamicilina dihidratado equivalente a 375 mg de sultamicilina equivalente a 220 mg de ampicilina y a 147 mg de sulbactam. Caja con seis o 10 tabletas de 375 mg sultamicilina. PFIZER.

ANFOTERICINA B

Antimicóticos • Antiprotozoarios

Propiedades farmacológicas

Antibiótico producido por *Streptomyces nodosus* con propiedades fungistáticas o fungicidas, lo cual depende de las concentraciones alcanzadas en los líquidos orgánicos y de la susceptibilidad de los microorganismos. Es altamente eficaz contra micosis sistémicas producidas por *Coccidioides immitis*, *Histoplasma capsulatum*, *Blastomyces dermatitidis*, *Cryptococcus neoformans*, *Sporothrix schenckii*, *Mucor mucedo*, *Aspergillus fumigatus* y especies de *Candida*. También tiene actividad contra algunos protozoarios: *Leishmania* y *Trypanosoma*. En los organismos, altera la permeabilidad de la membrana celular que contiene esteroides, lo que se traduce en pérdida de los componentes celulares. Se administra por vía endovenosa, y con las dosis recomendadas se alcanzan poco a poco concentraciones del orden de 2 a 4 mcg/ml. Se une de modo importante a las proteínas plasmáticas y se excreta lentamente en la orina, 5% en forma activa. Su presencia en la orina se determina en un lapso de siete semanas después de suspendida su administración. No se conocen detalles de su distribución tisular ni de sus vías metabólicas. Su vida es de aproximadamente 24 horas.

Indicaciones

Micosis sistémicas graves causadas por microorganismos susceptibles.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en casos de hipersensibilidad a la anfotericina, a menos que en opinión del médico esté en riesgo la vida del paciente. Deberá utilizarse el mismo criterio en casos de insuficiencia renal y de embarazo. Es un medicamento muy tóxico que sólo habrá de emplearse en infecciones micóticas potencialmente fatales. Su administración se llevará a cabo en pacientes hospitalizados, donde se tengan instalaciones para realizar pruebas de nitrógeno de la urea sanguínea y de creatinina sérica, las cuales deberán efectuarse por lo menos una vez a la semana durante el tratamiento. Si los valores de nitrógeno de la urea exceden de 40 mg/ml, el tratamiento deberá suspenderse, o la dosis se habrá de reducir hasta que se mejore la función renal. También se llevarán a cabo determinaciones de potasio sérico, funcionamiento hepático y biometría hemática. No se administrarán simultáneamente fármacos nefrotóxicos. Hay que preparar la solución como indica el fabricante.

Reacciones adversas

Frecuentes: anemia, reacciones a la administración (fiebre, escalofríos, náusea, vómito, cefalea, hipotensión), alteraciones de la función renal, hipopotasemia, anorexia, diarrea, dolor estomacal.

Poco frecuentes: insuficiencia renal aguda (oliguria, anuria), toxicidad cardiovascular (arritmias cardíacas, hipertensión, hipotensión), leucopenia, trombocitopenia, neuropatía (visión borrosa o doble, hipoacusia, adormecimiento de las extremidades).

Advertencias para el paciente

Medicamento potencialmente muy tóxico. Infórmese de inmediato alteraciones como: variaciones en el volumen de orina, dificultad en la visión, sangrado, irritación de la garganta, fiebre.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Infusión intravenosa. Micosis sistémica, la infusión intravenosa debe ser lenta y es preferible iniciar con una dosis de prueba de 1 mg, administrado en 20 a 50 ml de una solución de dextrosa al 5% durante un periodo de 10 a 30 min. Después se aumenta progresivamente la dosis, de conformidad con la tolerancia del paciente y la gravedad de la infección, hasta completar un máximo de 50 mg al día, administrados en un periodo de 2 a 6 h. La concentración recomendada de la solución para infusión intravenosa es de 0.1 mg/ml (1 mg/10 ml). Nunca deben excederse 1.5 mg/kg de peso al día. Para la preparación de las soluciones, ver instrucciones del fabricante.

Presentaciones

AMPHOCIL. Liofilizado para *solución inyectable*. Cada frasco ampula de solución inyectable contiene 50 ó 100 mg de anfotericina B y sulfato de colesterilo. Caja con 1 frasco ampula con 50 mg de liofilizado estéril para reconstituir con 10 ml de agua inyectable. Caja con 10 frascos-ampula con 50 mg de liofilizado estéril para reconstituir con 10 ml de agua inyectable. Caja con 1 frasco ampula con 100 mg de liofilizado estéril para reconstituir con 20 ml de agua inyectable. Caja con 10 frascos ampula con 100 mg de liofilizado estéril para reconstituir con 20 ml de agua inyectable. LEMERY.

ASPARAGINASA

Antineoplásicos

Propiedades farmacológicas

La L-asparaginasa (aminohidrolasa de L-asparagina), enzima proteínica que se obtiene del cultivo de algunas bacterias (*Escherichia coli*), es un producto altamente eficaz en el tratamiento de las leucemias agudas, en particular las linfocíticas, en las cuales las células malignas dependen de una fuente externa de asparagina, nutrimento esencial para su supervivencia. La L-asparaginasa fracciona la asparagina en ácido aspártico y amonio, acción que interfiere con la síntesis proteínica y con la formación de DNA y RNA en las células cancerosas. En contraste, casi todas las células normales son capaces de sintetizar asparagina y, por tanto, se ven afectadas en menor proporción, o menos intensamente, por la disminución de asparagina que produce la L-asparaginasa. Por ello, la L-asparaginasa es uno de los pocos ejemplos en la quimioterapia de las enfermedades malignas en el cual está clara la base de la selectividad bioquímica. Además, produce remisión de la enfermedad en niños, aun en procesos graves o avanzados. Su efecto sobre la división celular es específico y actúa de preferencia en la fase G₁. La influencia de la L-asparaginasa sobre las concentraciones sanguíneas de asparagina es prácticamente inmediata, y los valores se recuperan a los 23 a 33 días después de suspender la quimioterapia. Por otro lado, la asparaginasa también tiene propiedades inmunosupresoras. La L-asparaginasa se administra por vía intramuscular o intravenosa. Su unión a las proteínas plasmáticas es más o menos baja (30%) y su volumen aparente de distribución es cercano a 70 a 80% del volumen plasmático estimado; en el líquido linfático y en el cefalorraquídeo alcanza concentraciones muy bajas (menos de 1% de la concentración plasmática). Se biotransforma muy lentamente en el retículo endotelial y se elimina en la orina. Su vida media por vía intramuscular es de 39 a 49 h, y por vía endovenosa de 8 a 30 horas.

Indicaciones

Tratamiento de la leucemia linfocítica aguda, en combinación con otros quimioterapéuticos.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en casos de hipersensibilidad a la L-asparaginasa, pancreatitis o antecedentes de pancreatitis aguda, varicela, herpes zoster, disfunción hepática o renal, infecciones sistémicas, alcoholismo, durante el embarazo y la lactancia. Su administración hace que aumenten las concentraciones sanguíneas de glucosa y de ácido úrico. La reacción de hipersensibilidad es uno de los riesgos más importantes durante su administración; son poco comunes con la primera aplicación, pero su frecuencia aumenta con las subsecuentes. Las pruebas cutáneas para predecir las reacciones alérgicas sólo son parcialmente útiles; sin embargo, se recomienda efectuar la prueba antes de la primera administración y cuando ha pasado más de una semana entre cada dosis. Los pacientes que reciben L-asparaginasa por segunda o más ocasiones deben ser observados con detenimiento por varias horas y se debe tener a la mano adrenalina, ante la posibilidad de que se produzcan reacciones anafilácticas. Evítase la administración simultánea de fármacos que aumenten las concentraciones sanguíneas de glucosa (glucocorticoides, vincristina) o de ácido úrico (sulfipirazona, probenecid). La L-asparaginasa aumenta los efectos de los inmunosupresores y de la radiación. También bloquea el efecto antitumoral del metotrexato.

Reacciones adversas

Frecuentes: anorexia, náusea, vómito, dolor abdominal, reacciones alérgicas leves (prurito, erupción cutánea, inflamación articular, etc.) a graves o mortales (anafilácticas), pancreatitis, hepatotoxicidad, disminución del fibrinógeno y de otros factores de la coagulación.

Poco frecuentes: hiperglucemia, hiperuricemia, hipoalbuminemia, estomatitis, insuficiencia renal, depresión nerviosa, confusión, somnolencia.

Raras: leucopenia, infecciones agregadas, hipertermia, trombosis, hemorragia intracranial.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Intravenosa. 50 a 200 UI/kg de peso al día durante 28 días. Antes de su empleo el polvo deberá disolverse en 3 ó 4 ml de solución salina o de agua inyectable.

Niños:

Venoclisis. Como agente único, 200 UI por kg de peso por día durante 28 días. *Intramuscular*. Como parte del régimen terapéutico, 6 000 UI/m² de superficie corporal los días cuatro, siete, 13, 16, 19, 22, 25 y 28 del periodo de tratamiento en combinación con vincristina y prednisona. En ambos casos, la dosis deberá ajustarse a la edad y condiciones del paciente. Antes de su empleo, el polvo del frasco ampula deberá reconstituirse con solución salina o con agua inyectable.

Presentaciones

LEUNASE. *Solución inyectable*. Cada frasco con polvo contiene 10 000 UI de L-asparaginasa. Caja con uno o cinco frascos. SANFER.

ASTEMIZOL

Antihistamínicos • Antialérgicos

Propiedades farmacológicas

Antagonista competitivo de la histamina en los receptores H_1 de las células efectoras. Inhibe casi todas las respuestas del músculo liso a la histamina y es muy eficaz para impedir el aumento de la permeabilidad capilar, la formación del edema y el prurito que se presentan en las reacciones de hipersensibilidad inmediata. Su efecto terapéutico se opera lentamente (dos a tres días) y persiste por varias semanas. No inhibe la liberación de histamina, la producción de anticuerpos ni la reacción antígeno-anticuerpo. A diferencia de otros antihistamínicos, sus efectos anticolinérgicos no son significativos, y en dosis terapéuticas carece de efectos sedantes, ya que no atraviesa la barrera hematoencefálica. Se absorbe bien en el tubo digestivo, y las concentraciones plasmáticas máximas se alcanzan 1 a 4 h después de su administración. Se une en forma importante a las proteínas plasmáticas (96%) y desaparece del plasma con una vida media aproximada de 36 h. Se metaboliza en el hígado, en particular hasta convertirse en desmetilastemizol, que también tiene propiedades antihistamínicas. Este metabolito tiene una vida media de 12 días, lo que explica el efecto persistente del astemizol una vez que se suspende su administración. Sus metabolitos se eliminan sobre todo en las heces.

Indicaciones

Rinitis alérgica. Rinitis vasomotora. Rinorrea. Conjuntivitis alérgica. Fiebre del heno. Urticaria. Prurito. Reacciones alérgicas debidas a medicamentos o alimentos. Picaduras de insectos.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al astemizol, insuficiencia hepática, durante el embarazo y la lactancia, asma aguda, hipertrofia prostática, retención urinaria, glaucoma. Para facilitar su absorción, adminístrese antes del desayuno. Aun cuando no haya efectos sedantes o sean mínimos, se debe evitar su uso en personas que por su trabajo estén expuestas a alto riesgo.

Reacciones adversas

Poco frecuentes: aumento del apetito por administración prolongada.

Advertencias para el paciente

Tómese antes del desayuno.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral: 10 mg cada 24 horas.

Niños:

Oral. Mayores de seis años, 2 mg por cada 10 kg de peso corporal cada 24 h. No debe exceder de 10 mg en 24 horas.

Presentaciones

ASTESEN. *Comprimidos*. Cada comprimido contiene 10 mg de astemizol. Envase con 10 comprimidos. *Suspensión*. Cada 100 ml de suspensión contienen 0.2 g de astemizol y vehículo cbp 100 ml. Caja con frasco con 30 ml. SENOSIAN.

ATENOLOL

Antiadrenérgicos • Antihipertensores • Antianginosos

A

Propiedades farmacológicas

Bloqueador adrenérgico beta con mayor afinidad por los receptores beta₁, por lo que se denomina selectivo; actúa de preferencia sobre el corazón. Carece de actividad simpaticomimética y no deprime la excitabilidad de la membrana celular. Su selectividad por los receptores beta₁ en el corazón es relativa, ya que sólo ocurre con dosis bajas; conforme aumenta la dosis también bloquea los receptores beta₂ localizados en distintas partes del organismo. Al igual que otros miembros del grupo, el atenolol produce efectos cronotrópicos e inotrópicos negativos. Reduce la frecuencia sinusal, hace que disminuya la frecuencia espontánea de despolarización de los marcapasos ectópicos, y la conducción auricular y auriculoventricular, y aumenta el periodo refractario funcional del nodo auriculoventricular. En general, tiende a disminuir la capacidad de trabajo del corazón. Asimismo, baja la presión arterial en hipertensos. Esta caída de la presión arterial guarda relación con disminución a largo plazo de la resistencia periférica. Se absorbe en forma incompleta en el tubo digestivo (50%). Su efecto máximo se observa 2 a 4 h después de su administración oral. Se fija un 5% en proteínas plasmáticas. Por su baja liposolubilidad penetra poco en los tejidos, y en el sistema nervioso central se encuentran cantidades insignificantes. Su metabolismo hepático es mínimo. La vida media plasmática es de 6 a 7 h, y puede aumentar de 16 a 27 h en pacientes con alteración de la función renal. La principal vía de excreción es la renal (85 a 100% sin alteraciones metabólicas); también se elimina en pequeñas cantidades en la leche materna.

Indicaciones

Tratamiento de la hipertensión arterial. Tratamiento de la angina de pecho crónica.

Contraindicaciones y precauciones

El atenolol está contraindicado en pacientes hipersensibles a este tipo de medicamentos; asimismo, en casos de insuficiencia cardíaca congestiva, choque cardiogénico, bradicardia sinusal, bloqueo auriculoventricular, hipotensión, enfermedades pulmonares broncoespásticas y durante el embarazo. Úsese con precaución en enfermos con asma bronquial, síndrome de Raynaud, otras enfermedades vasculares periféricas e insuficiencia renal. Es necesario ajustar la dosis en pacientes con eliminación de creatinina menor de 35 ml/min. El atenolol interactúa con anestésicos generales que tengan propiedades cronotrópica e inotrópica negativas, como halotano, produciéndose depresión miocárdica e hipotensión. Su asociación con antiinflamatorios no esteroideos reduce el efecto antihipertensor. Su uso concomitante con clonidina causa hipertensión. Con los bloqueadores de canales del calcio, como verapamilo, por sumación de efectos (efecto aditivo) causa insuficiencia cardíaca, alteraciones en la conducción auriculoventricular y bradicardia sinusal. Su empleo simultáneo con glucósidos cardioactivos origina bradicardia excesiva con trastornos de la conducción. Los adultos mayores son más susceptibles a sus efectos hipotensores. La suspensión brusca de su administración provoca ataque de angina.

Reacciones adversas

Frecuentes: impotencia.

Poco frecuentes: náusea, vómito, diarrea, vértigo, cansancio o debilidad, bradicardia, edema de las extremidades, dificultad para respirar (broncoespasmo), manos y pies fríos, depresión mental.

Raras: dolor de pecho, erupción cutánea, somnolencia, pesadillas.

A

Advertencias para el paciente

Evítese el manejo de maquinaria peligrosa y la conducción de automóviles. No debe interrumpirse en forma brusca la administración del medicamento. Se informará de inmediato al médico si se presentan algunas de las siguientes manifestaciones: dificultad respiratoria, edema de las extremidades, depresión mental, erupción cutánea. Consúltese al médico si se requiere tomar otros medicamentos.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Angina de pecho, inicial: 50 mg una vez al día. Si es necesario y se tolera bien, puede aumentarse gradualmente la dosis hasta 100 mg después de una semana. Algunos pacientes requieren hasta 200 mg diarios. Hipertensión arterial, inicial: 25 a 50 mg una vez al día. Si es necesario y el fármaco es bien tolerado, la dosis puede aumentarse de 50 a 100 mg al día después de dos semanas.

Niños:

La dosis no ha sido bien establecida y por esta razón no se recomienda su uso.

Presentaciones

ATOKEN. Tabletas. Cada tableta contiene 50 ó 100 mg de atenolol. Caja con 28 tabletas de 50 mg. Caja con 28 tabletas de 100 mg. *KENDRICK.*

TENORMIN. Tabletas. Cada tableta contiene 50 ó 100 mg de atenolol. Caja con 28 tabletas de 50 ó 100 mg en envase de burbuja calendarizado. *ASTRAZENECA.*

ATRACURIO

Anticolinérgicos • Relajantes musculares

A

Propiedades farmacológicas

Agente bloqueador neuromuscular no despolarizante (competitivo) que interrumpe la transmisión del impulso nervioso en la unión neuromuscular esquelética por competir con la acetilcolina en los receptores colinérgicos nicotínicos de la placa motora, acción que se manifiesta por relajación muscular periférica. Por vía intravenosa, su efecto relajante se inicia en 2 min; es máximo en 3 a 10 min; dura 20 a 35 min, y tiene un tiempo de recuperación de 35 a 70 min. El efecto relajante se antagoniza con medicamentos anticolinesterásicos, como piridostigmina, neostigmina y edrofonio. El atracurio induce la liberación de histamina. Por otro lado, su administración ocasiona taquicardia y bloqueo vagal; o bien, hipotensión transitoria y broncoconstricción, efectos antagonizados por la atropina. El atracurio se administra en dosis única o infusión continua por vía intravenosa; se une en alta proporción a las proteínas plasmáticas y se biotransforma por esterasas plasmáticas específicas y no específicas. Cruza la barrera placentaria en pequeñas cantidades que no modifican la actividad del músculo esquelético ni la respiración del neonato. La vida media del atracurio es de 15 a 20 min y 10% se elimina sin cambios por vías renal y biliar.

Indicaciones

Para producir relajación del músculo esquelético durante la anestesia quirúrgica. Para facilitar la laringoscopia, broncoscopia y esofagoscopia.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicado en casos de hipersensibilidad al atracurio, o al alcohol benzílico, hipotensión, estado de choque y durante el embarazo. Antes de su administración, téngase disponible equipo de intubación endotraqueal y ventilación artificial. Extremar las precauciones en pacientes con miastenia grave, desequilibrio electrolítico grave, en obesos, en miopatías, en enfermos caquéticos y en casos de daño cardiovascular. Recuérdese que produce liberación de histamina en pacientes susceptibles. La administración de atracurio combinada con anestésicos generales (enflurano, isoflurano y metoxiflurano) implica reducir la dosis del relajante en 50%, y con el halotano en 30%. No se recomienda combinarlo con un despolarizante como succinilcolina, decametonio o cloruro de suxametonio, ni con otro antidespolarizante, ya que resulta difícil revertir los efectos de intoxicación. Vigílese la combinación con anestésicos generales, antibióticos polipeptídicos, aminoglucósidos, diuréticos tiazídicos, opioides, sales de magnesio, de litio y quinidina, porque estos medicamentos potencian los efectos relajantes y depresores de la respiración.

Reacciones adversas

Poco frecuentes: hipotensión arterial, bradicardia algunas veces seguida de taquicardia, enrojecimiento de la piel, debilidad muscular prolongada y miopatías.

Raras: dificultad respiratoria (broncoespasmo por liberación de histamina), erupción cutánea.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Intravenosa. Relajación muscular completa, dosis única inicial: 0.4 a 0.5 mg/kg de peso, que mantiene la relajación durante 15 a 35 min. Las dosis complementarias son de 80 a 100 mcg/kg de peso, 20 a 25 min luego de la dosis inicial; después, cada 15 a 25 min, de acuerdo

A

con las necesidades y condiciones del paciente. *Infusión endovenosa.* Para casos de procedimientos quirúrgicos prolongados, después de la dosis inicial: 0.3 a 0.6 mg/kg/h. Tómese en cuenta que el atracurio es compatible con las soluciones de cloruro de sodio, glucosada y Ringer con lactato. Su estabilidad varía entre 4 y 24 horas.

Niños:

Intravenosa. Mayores de dos años, véase dosis del adulto.

Presentaciones

TRACRIUM. *Solución inyectable.* Cada ampolleta de solución inyectable contiene 10 mg/ml de besilato de atracurio. Caja con 1 ampolleta de 2.5 ml con 25 mg de atracurio. Caja con una ampolleta de 5 ml con 50 mg de atracurio. GLAXOSMITHKLINE.

AZATIOPRINA

A

Inmunodepresores

Propiedades farmacológicas

Agente inmunodepresor, derivado imidazólico de la 6-mercaptopurina, que altera el metabolismo de las purinas e inhibe la síntesis de DNA, RNA y proteínas; también disminuye el metabolismo celular e inhibe la mitosis. Se utiliza por su capacidad para prevenir el rechazo de los tejidos y órganos trasplantados. No se conoce con precisión su mecanismo de acción y se ha observado que sus efectos inmunosupresores se relacionan más con retraso de la hipersensibilidad y toxicidad celular que con la producción de anticuerpos. Es útil en la artritis reumatoide y en otros procesos de carácter inmunológico. En la artritis reumatoide, su efecto es evidente a las seis u ocho semanas de iniciado el tratamiento. Se absorbe a través de la mucosa gastrointestinal; se biotransforma en los eritrocitos y en el hígado, donde se convierte en 6-mercaptopurina, su metabolito activo. Su vida media es de 3 h, y se elimina a través de la orina y la bilis.

Indicaciones

Profilaxis del rechazo del homotrasplante renal. Artritis reumatoide activa y grave que no responde al tratamiento convencional. Lupus eritematoso generalizado.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en mujeres embarazadas, en individuos hipersensibles a la azatioprina y en pacientes previamente tratados con agentes alquilantes. El alopurinol y la radioterapia hacen que aumenten sus efectos. Se recomienda efectuar biometría hemática semanal y, en caso de leucopenia rápida y grave, suspender el tratamiento; asimismo, hay que llevar a cabo estudios periódicos de la función hepática. La infección por hongos, protozoarios, virus o bacterias es un riesgo continuo durante la administración de este fármaco.

Reacciones adversas

Frecuentes: anorexia, náusea, vómito, fiebre, escalofrío, dolor de garganta, leucopenia, infecciones, cansancio y debilidad.

Poco frecuentes: sangrado, trombocitopenia, hepatotoxicidad; esta última es más frecuente con dosis mayores de 2.5 mg/kg/día.

Raras: reacciones de hipersensibilidad desde leves hasta muy graves. En este caso es necesario suspender el tratamiento.

Advertencias para el paciente

En caso de molestias gastrointestinales, tómese junto con los alimentos. Hay que informar de inmediato al médico en caso de que se presente alguna de las siguientes manifestaciones: sangrado, hematomas, fiebre, dolor de garganta, dolor abdominal, oscurecimiento de la orina, heces blanquecinas, erupción cutánea.

Vía de administración y dosis

Adultos:

Oral. Profilaxis del rechazo de trasplante renal, 3 a 5 mg/kg de peso por día durante tres días antes de la intervención quirúrgica; dosis de mantenimiento de 1 a 2 mg/kg/día. Lupus eritematoso generalizado y artritis reumatoide, 1 mg/kg/24 h; en casos graves, esta dosis se incrementa paulatinamente hasta ajustar un máximo de 2.5 mg/kg/día.

A**Presentaciones**

AZATRILEM. *Tabletas.* Cada tableta contiene 50 mg de azatioprina. Caja con 50 tabletas. LEMERY.

IMURÁN. *Tabletas.* Cada tableta contiene 50 mg de azatioprina. Caja con 25 tabletas en envase alveolado. GLAXOSMITHKLINE.

AZITROMICINA

Antimicrobianos

A

Propiedades farmacológicas

Como otros macrólidos, en microorganismos susceptibles se une a la subunidad ribosómica 50S y suprime la síntesis proteínica. Es bacteriostática y puede ser bactericida en concentraciones altas o en microorganismos altamente susceptibles. Su espectro útil incluye a microorganismos aeróbicos grampositivos (*S. pneumoniae*, *S. pyogenes* y *S. aureus*), gramnegativos (*H. influenzae*, *H. parainfluenzae*, *M. catarrhalis*, *B. pertussis*), atípicos y *M. avium-intracellulare*. También es activa contra *P. multocida*, *N. gonorrhoeae*, y especies de *Campylobacter*. Es capturada rápida y extensamente por el medio intracelular y permanece en los macrófagos pulmonares, tejido amigdalino, pélvico y genital. Razón de su utilidad contra bacterias intracelulares (atípicas) como *M. pneumoniae*, *L. pneumophila*, *C. pneumoniae*, *C. trachomatis* y contra micobacterias no tuberculosas, como *M. avium-intracellulare*. Tiene efecto posantibiótico. Se absorbe bien en el tracto gastrointestinal y su absorción no guarda relación con las comidas. Se distribuye ampliamente en el organismo y alcanza concentraciones útiles en diversos líquidos y tejidos: secreciones bronquiales, uretra, cérvix, ovarios, oído. No cruza la barrera hematoencefálica y alcanza concentraciones bajas en el líquido sinovial. Sus concentraciones plasmáticas pico se presentan en 2 a 4 h. Se une moderadamente a proteínas plasmáticas, se metaboliza en hígado, se elimina en orina y bilis, y entra al ciclo enterohepático. Su vida media de eliminación es de aproximadamente 68 horas.

Indicaciones

Infecciones causadas por organismos susceptibles, incluidas las respiratorias (bronquitis, neumonía leve a moderada, sinusitis, faringoamigdalitis, otitis media) e infecciones de transmisión sexual como gonorrea, uretritis y cervicitis.

Contraindicaciones y precauciones

Contraindicada en casos de hipersensibilidad a azitromicina o a algún otro macrólido o cetólido. Evítese su uso durante el embarazo. No usar en pacientes con neumonía grave, los cuales son inapropiados para terapia oral. Usar con precaución en pacientes con daño renal o hepático e intervalo QT prolongado. Puede aumentar las concentraciones de fenitoína, ergotamina, astemizol, carbamazepina, warfarina. La coadministración con cloranfenicol o clindamicina puede disminuir su eficacia.

Reacciones adversas

Frecuentes: molestias gastrointestinales como diarrea, dolor, náusea, vómito.

Poco frecuentes: cefalea, vértigo, alteraciones del gusto, ototoxicidad, que puede ocurrir con dosis altas por tiempo prolongado.

Raras: hepatotoxicidad, nefritis intersticial, hipersensibilidad, anemia, leucopenia, trombocitopenia, arritmias cardíacas.

Advertencias para el paciente

No abandonar el tratamiento. Informar de inmediato al médico en caso de diarrea o de manifestaciones de alergia como salpullido, edema de manos, cara o boca, disnea.

A**Vía de administración y dosis****Adultos:**

Oral. En general, 500 mg al día por tres días, o 500 mg el día uno, seguido por 250 mg al día hasta completar cinco días. No exceder de 500 mg al día. Gonorrea, uretritis o cervicitis, 2 g en dosis única. Uretritis o cervicitis no gonocócica, 1 g en dosis única.

Niños mayores de seis meses:

Oral. En general, 10 mg/kg una vez al día por tres días, o 10 mg/kg en el día uno, seguida de 5 mg/kg una vez al día hasta completar cinco días. La dosis máxima no debe exceder de 500 mg al día.

Presentaciones

AZITROCIN. *Tabletas.* Cada tableta contiene azitromicina dihidratada equivalente a 500 mg de azitromicina. Caja con tres tabletas. *Suspensión.* Cada frasco con polvo contiene azitromicina dihidratada equivalente a 600 ó 900 mg de azitromicina. Caja con frasco con polvo para 15 ml (600 mg) o 22.5 ml (900 mg). **Pfizer.**

ZITROKEN. *Tabletas.* Cada tableta contiene dihidrato de azitromicina equivalente a 500 mg de azitromicina. Caja con tres tabletas. **Kendrick.**