ANTIULCEROSOS

SUMARIO

Concepto de úlcera péptica. Etiopatogenia. Clasificación de las drogas antiulcerosas. Aspectos farmacológicos de drogas antiulcerosas mas empleadas.

Pautas internacionales de tratamiento.

ULCERA PÉPTICA. CONCEPTO

Pérdida circunscrita de tejido que reviste las partes del tubo digestivo expuestas a la acción del jugo gástrico

ETIOPATOGENIA

FACTORES DEFENSORES	FACTORES AGRESORES
Resistencia de la mucosa	Secreción de HCl y pepsina
Microcirculación	Volumen células parietales
PGS (E2, I2)	Drogas

ETIOPATOGENIA

Agente causal :

HELICOBACTER PILORY

CLASIFICACIÓN

- 1- AGENTES QUE REDUCEN LA SECRECIÓN ÁCIDO-PÉPTICA:
 - A) Antiácidos (Por neutralización): MgOH2, AlOH2, Bicarbonato de Sodio
 - B) Anticolinérgicos (Por bloqueo colinérgico) : Atropina, Pirenzepina, Propantelina
 - C) Antihistamínicos (Por bloqueo histaminérgico) : Cimetidina, Ranitidina, Famotidina, Nizatidina

CLASIFICACIÓN

D) Por inhibición de la bomba de pro-

tones:

Omeprazol, Lansoprazol,

Pantoprazol, Esomeprazol, Rabeprazol

CLASIFICACIÓN

2- AGENTES QUE AUMENTAN LA PROTECCION DE LA MUCOSA (CITOPROTECTORES):

Prostaglandinas (Misoprostol), Subcitrato de Bismuto

3- Otros agentes: Metronidazol, Metoclopramida.

ACCIÓN LOCAL ACCIÓN SISTÉMICA

-Mg(OH)2 -Bicarbonato de Na

-CO₃Ca -Citrato de Na

-Al(OH)3

-Trisilicato de Mg

Acción local:

Permanecen en estómago e intestino, formando complejos insolubles. Ácción prolongada.

Acción sistémica:

Neutraliza el HCl del estómago. Acción pasajera por su absorción rápida.

CUANDO SE ADMINISTRAN CANTIDADES

QUE LLEVAN EL Ph MAYOR QUE 6, SE

SUPRIME LA ACTIVIDAD DE LA PEPSINA

INDIRECTAMENTE

Los que contienen Magnesio:

AUMENTAN la motilidad gastrointestinal, son catárticos a altas dosis

Los que contienen Aluminio:

RETARDAN el vaciamiento gástrico

MECANISMO DE ACCIÓN:

Neutralización del ácido ya formado sin afectar la actividad péptica si el ph no pasa de 6.

Acción DEMULCENTE (forman una capa protectora sobre la superficie lesionada de la mucosa)

INTERACCIONES

 Los antiácidos modifican la absorción, biodisponibilidad y eliminación de : Alopurinol, Antimicóticos y Hormonas Tiroideas

(debido a los cambios de pH)

INTERACCIONES

 Los que contienen MAGNESIO o ALUMINIO disminuyen la absorción gastrointestinal de las tetraciclinas, propranolol, sulfadiacina, clorpromacina, digoxina, indometacina, isoniacida, anticolinérgicos, prednisona, prednisolona, cimetidina, vitaminas liposolubles

(por formación de complejos insolubles)

TOXICIDADES

Los que contienen ALUMINIO: Osteoporosis, encefalopatía, Miopatías

Los que contienen CALCIO:

Hipercalcemia transistoria (dosis bajas)

Síndrome de la leche y los alcalinos (alcalosis, hipercalcemia, litiasis, insuficiencia renal)

TOXICIDADES

BICARBONATO DE SODIO y CARBONATO DE CALCIO:

Distensión gástrica, aerogastria, nauseas, flatulencia

TOXICIDADES:

Los que contienen MAGNESIO: Diarreas

Los que contienen ALUMINIO: Constipación

LOS ANTIACIDOS SE ADMNISTRAN POR VIA ORAL, ENTRE UNA Y TRES HORAS DESPUES DE LAS COMIDAS Y AL ACOSTARSE

TRATAMIENTO TAN EFICAZ COMO UN ANTAGONISTA H-2

```
ALCALOL (polvos alcalinos):Subcarbonato de Bismuto, Carbonato de calcio, Carbonato de Magnesio, Sal de Vichy, Fenobarbital ALUSIL: Gel de AlOH3 desecado, Trisilicato de Magnesio-----tabletas-----Gel de AlOH3---suspensión---
```

SILOGEL: Gel de AlOH3 desecado, Trisilicato de Mg, Metilpolisiloxano

GASTROSAN (polvo) : AlOH, MgOH, sacarina (excipiente)

GASTRIBIEN : AlOH, Trisilicato de Mg, sacarina

ANTIÁCIDOS mas ANTIESPASMÓDICOS

SERVENTINAL: AIOH, Belladona, Carbonato de calcio, MgOH, bicarbonato de sodio

CONTRAINDICADO en Estenosis Pilórica (disminuye vaciamiento gástrico)

- BLOQUEADORES MUSCARÍNICOS NO SELECTIVOS: Atropina, Metilbromuro de Homatropina, Oxifenciclimina, Propantelina, Tintura de Belladona
- BLOQUEADORES MUSCARÍNICOS
 SELECTIVOS (M1): Pirenzepina, Telenzepina

MECANISMO DE ACCIÓN:

Bloquean competitivamente las acciones de la Acetilcolina en los receptores muscarínicos

Son CITOPROTECTORES a bajas dosis

Poco usados en la terapéutica antiulcerosa actual por:

- Baja eficacia
- Producen muchos efectos colaterales

VÍAS DE ADMINISTRACIÓN Oral, IM, EV

PREPARADOS:

Propantelina: tabletas (15 mg)

Oxifenciclimina: tabletas (10 mg)

Pirenzepina: tabletas (25 mg)

CIMETIDINA FAMOTIDINA

RANITIDINA

EFECTO ANTISECRETORIO, no interfiriendo con otras funciones digestivas (no modifica vaciamiento gástrico, ni las secreciones pancreáticas ni las concentraciones séricas de gastrina)

MECANISMO DE ACCIÓN:

Bloquea competitivamente los receptores H-2 de las células parietales gástricas

TOXICIDADES:

SISTEMA DIGESTIVO: Diarreas o constipación, Aumento creatinina y transaminasas, cáncer gástrico (nitrosoguanidina)

SNC : Cefalea, somnolencia, confusión, trastornos del lenguaje, alucinaciones, delirio

TOXICIDADES:

SHLP: Trombocitopenia

S. ENDOCRINO: Galactorrea, Ginecomestia, Impotencia

OTROS: Astenia, dolores musculares, Tolerancia, EFECTO REBOTE PRECAUCION en EMBARAZADAS y OTROS

GRUPOS DE RIESGO

INTERACCIONES

- 1- Los ANTIACIDOS reducen su absorción y biodisponibilidad
- 2- La CIMETIDINA inhibe el metabolismo hepático de : anticoagulantes orales, fenitoína, carbamazepina, propranolol, lidocaína, diazepam, teofilina, quinidina, alcohol

VÍAS DE ADMINISTRACIÓN:

Cimetidina, Ranitidina, Famotidina :
ORAL , INTRAMUSCULAR y ENDOVENOSA

Nizatidina: ORAL

PROSTAGLANDINAS

Ácidos grasos insaturados que se sintetizan y liberan en numerosos tejidos y que poseen variadas acciones farmacológicas y fisiológicas.

EN MUCOSA GÁSTRICA HUMANA:

Prostaglandina E2

Prostaglandina I2 (Prostaciclina)

ANALOGOS DE PROSTAGLANDINAS

Mecanismo de acción:

------ Inhiben la secrección ácida gástrica estimulada por los alimentos, la histamina o la gastrina, debido a:

Interacción con receptores

(células parietales)

Disminuyen GMPc intracelular

----- Citoprotección (PGE2)

ANALOGOS DE PROSTAGLANDINAS

PG E1-----MISOPTROSTOL

ANALOGOS DE PROSTAGLANDINAS

Toxicidadades:

DIARREAS (+ frecuente)

Còlicos, náuseas, vómitos, diarreas, dolor abdominal

CONTRAINDICADO en el embarazo (aumenta la contractilidad uterina)

Vía de administración:

ORAL

COMPUESTOS DE BISMUTO

- SUBSALICILATO DE BISMUTO (Pepto- Bismol)
- SUBCITRATO DE BISMUTO
 (Denol y Q-ulcer)

- -Tiene GRAN afinidad por el tejido necrótico del cráter de la úlcera, cubriéndolo con una capa blanca poco permeable al H₃O, constituyendo una BARRERA AL ÁCIDO GÁSTRICO
- Aumenta secreción de mucina y bicarbonato
- Promueve la síntesis local de Pgl2
- Produce la muerte del Helicobacter Pilory

Toxicidades:

- 1- Color negro de las heces
- 2- Ennegrecimiento de la lengua y dientes
- 3- Náuseas, Vómitos, Reacciones de hipersensibilidad
- 4- Encefalopatía reversible por uso prolongado
- 5- Insuficiencia renal crónica por sobredosis

Interacciones:

- 1- Los antiácidos, leche y alimentos deben darse media hora después, porque el medio ácido es necesario para la formación de la capa protectora.
- 2- Disminuye la absorción de Tetraciclinas

ESTAN EFECTIVO O MAS QUE LA CIMETIDINA Y RANITIDINA

ES MENORY MAS TARDÍA LA RECIDIVA

VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Oral (tabletas de 120 mg)

DOSIS : 1 tab. media hora antes de D,A,C y al acostarse (durante 4-8 semanas)

Omeprazol

Lansoprazol

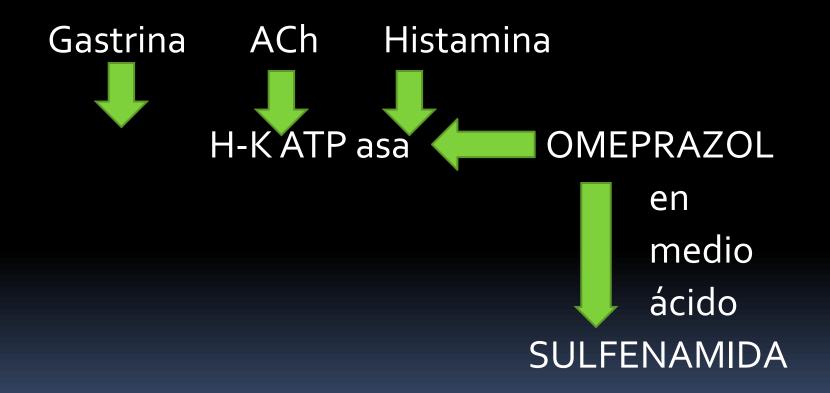
Pantoprazol

Esomeprazol

Rabeprazol

MECANISMO DE ACCIÓN:

Inhibe secreción ácida provocada por Histamina, Gastrina y Acetilcolina, por INHIBICIÓN IRREVERSIBLE DE LA ENZIMA H-K ATP asa, en las membranas de las células parietales



EFECTOS INDESEABLES:

- 1- TGI: Náuseas, dolor abdominal, constipación, flatulencia, diarreas
- 2- Otros efectos: Miopatía subaguda, artralgias, cefalea, rash cutáneo

Hipergastrinemia

EFECTO DE REBOTE

INTERACCIONES

- 1- Disminuyen la inactivación de Warfarina y Diazepán
- 2- Omeprazol, disminuye la absorción de Vitamina B-12 (uso crónico)
- 3- La disminución de la acidez gástrica puede afectar la biodisponibilidad de Ketoconazol, Ampicilina y Sales de Hierro

VÍAS DE ADMINISTRACIÓN: ORAL ENDOVENOSA

(DOSIS ÚNICA DIARIA)

ANTIMICROBIANOS EFECTIVOS CONTRA EL HELICOBACTER PYLORI:

Amoxicilina
Metronidazol
Tetraciclina
Claritromicina

TERAPIA TRIPLE

Bismuto Ranitidina Ranitidina

Tetrac. (A) Bismuto Amoxicilina

Metronidazol Claritromicina Claritromic.

(2 semanas)

TERAPIA DOBLE

Omeprazol o Lanzoprazol Claritromicina

(2 semanas)

INHIBIDORES DE LA BOMBA DE PROTONES

+ 2 Antimicrobianos

OMEPRAZOL O LANZOPRAZOL
CLARITROMICINA
AMOXICILINA (METRONIDAZOL)

(10 días)

TERAPIATRIPLE + OMEPRAZOLO

LANZOPRAZOL

(1SEMANA)

0

TERAPIATRIPLE + RANITIDINA (2 SEMANAS)

DESPUES DE LAS 2 SEMANAS: CLARITROMICINA (14 días)

TERAPIA TRIPLE POR 14 DIAS:

I.B. P. + Claritromicina+ Metronidazol o Amoxicilina o Tetraciclina

TERAPIA CUADRUPLE POR 14 DIAS:

I.B.P. + Metronidazol + Subsalicilato de Bismuto + Tetraciclina

O

Antag. H-2 + Subsalicilato de Bismuto + Metronidazol + Tetraciclina

ANTIULCEROSOS

Úlcera gástrica que no responde al tratamiento



ADENOCARCINOMA ULCERADO