

EFERVESCENTES ANTIHELMÍNTICOS¹

AÑEZ VANIA; DAZA M. ANGELICA; DOMINGUEZ DENISSE; OLIVA GLORIA; PEREIRA CARLA; URZAGASTE HECTOR²; CABALLERO OLGA; CUELLAR JUANA; PAREDES EDGAR³

RESUMEN

La parasitosis es una enfermedad causada por protozoos y helmintos, se presenta en niños y adultos, el grado de la enfermedad depende de la carga parasitaria. En este trabajo se describe dos tipos de helmintos los cuales son causantes de anemias y desnutrición.

La presencia de estos helmintos (Uncinarias y Strongyloides Stercoralis), en el organismo humano en este caso llamado huésped, se da por la penetración de los parásitos a través de la piel, en especial la de los pies.

Se plantea que una de las opciones para el tratamiento o eliminación de estos parásitos es el uso del Mebendazol diseñado bajo la forma farmacéutica de un efervescente, esto con la finalidad de lograr una mejor absorción y mayor efecto del medicamento.

ABSTRACT

The parasite is a disease caused by protozoa and helminths, occurs in children and adults, the extent of the disease depends on the parasite burden. This paper describes two types of worms which are causing anemia and malnutrition. The presence of these helminths (hookworm and Strongyloides stercoralis) in the human body in this case called the host, is given by the penetration of the parasite through the skin, especially feet. It is argued that one of the options for treatment or disposal of these parasites is the use of mebendazole designed in the form of an effervescent pharmaceutical, that in order to achieve better absorption and greater effect of the drug.

PALABRAS CLAVE

Antihelmínticos. Efervescentes. Parasitosis

KEYWORDS

Anthelmintics. Effervescent. Parasites.

HECHO CIENTÍFICO A DEMOSTRAR

Preparación de una forma farmacéutica efervescente a base de Mebendazol como droga alternativa para el tratamiento contra los helmintos.

PROPÓSITO EDUCATIVO DEL TRABAJO A EXPONER

Informar sobre los riesgos que un paciente puede sufrir cuando está parasitado y el deterioro de su salud que puede terminar en muerte por falta de un tratamiento adecuado.

Como alternativa al tratamiento de los helmintos se utiliza el Mebendazol en sus diferentes formas farmacéuticas, en esta oportunidad se elabora un efervescente con la finalidad de conseguir una mejor absorción del fármaco y por ende un mejor efecto.

MATERIALES E INSTRUMENTOS UTILIZADOS

Se dispone de medios visuales, banners, acerca del tema.

Se demuestra la forma farmacéutica efervescente en sobres a base de Mebendazol como una opción accesible y eficaz como antihelmíntico

Objetivo General

Diseñar una forma farmacéutica (efervescente) para verificar el mayor poder de adsorción del Mebendazol.

1 Trabajo Ganador Feria Científica 2011, Categoría Exposición Carrera de Bioquímica y Farmacia UCEBOL

2 Estudiantes de la Carrera de Bioquímica y Farmacia, UCEBOL

3 Docentes asesores. Carrera de Bioquímica y Farmacia UCEBOL

Objetivos Específicos

Explicar las características de los parásitos (Uncinarias, Strongyloides Stercoralis) objetos de estudio

Describir el ciclo de vida de la Uncinarias y Strongyloides Stercoralis.

Explicar el mecanismo de acción del Mebendazol

Establecer la dosis indicada del Mebendazol para el tratamiento en niños y adultos.

Describir las ventajas y desventajas de los efervescentes

FUNDAMENTACIÓN TEÓRICA

Una enfermedad parasitaria o parasitosis es una enfermedad causada por protozoos o vermes (también conocidos como helmintos: cestodos, trematodos, nematodos) o artrópodos. Las infecciones producidas por hongos, bacterias y virus no son consideradas dentro de una parasitosis.

La parasitosis puede adquirirse a través de los alimentos o del agua contaminada, por la picadura de un insecto, o por contacto sexual. Puede causar desde molestias leves hasta la muerte.

Helmintos

Son organismos pluricelulares, término que significa gusanos parásitos, son llamados también Metazoarios, refiriéndose a especies animales de cuerpo largo o blando que infestan el organismo de otras especies; su tamaño puede variar, pudiendo llegar a alcanzar hasta varios metros de longitud en algunos casos.

Se reproducen sexualmente pudiendo ser hermafroditas o presentar sexos separados.

En este trabajo se hace énfasis en dos tipos de helmintos los cuales son Uncinarias y Strongyloides Stercoralis, los cuales son tratados con Mebendazol para eliminarlos del organismo del huésped. La selección de estos dos tipos de helmintos ha obedecido a la particularidad que tienen ambos de provocar anemia en el ser humano.

Uncinarias

Son el conjunto de dos parásitos iguales los cuales causan infecciones intestinales humanas. Estos son: Ancylostoma duodenale y Necátor americanus.

Ancylostoma duodenale

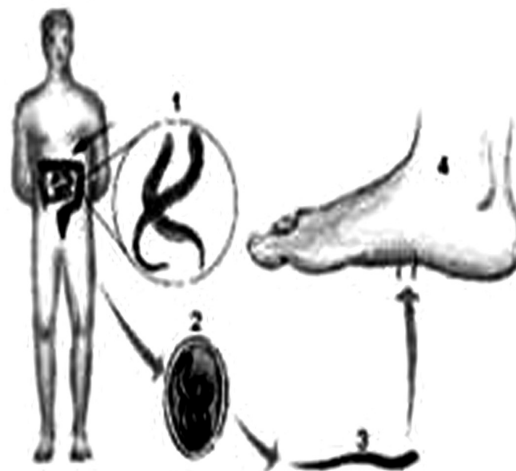
Es una especie de parásito del filo de los nematodos causante de una de las parasitosis más prevalentes en el mundo, en particular en países en desarrollo. Junto con la especie Necátor americanus son los causantes de la anquilostomiasis (anemia) en el hombre.

Es un gusano redondo cuya longitud oscila entre 8 a 12mm. Y el diámetro de 0.4 a 0.6mm. No mayor a 2cm de largo, son organismos con sexos separados. Carecen

de labios pero la boca está provista de una capsula con cuatro ganchos o dientes cortantes con las que se adhiere a las vellosidades de la mucosa del intestino.

La extremidad posterior termina en punta en las hembras, en una dilatación en forma de campana en el macho.

Ciclo de vida



En el suelo

El hábitat del parásito adulto es el intestino delgado, principalmente el duodeno, hospedador susceptible de estos helmintos. Como resultado de la cópula, la hembra deposita los huevos en la luz del tubo, los cuales son expulsados al exterior con las heces. El huevo termina por desarrollarse en el suelo húmedo hasta que eclosiona liberando una larva rhabditiforme o L1. Al cabo de varios días, esta sufre transformaciones en el suelo y se convierte en una larva filariforme o L3 el cual es la forma infectante para el hombre.

En el huésped

Una vez que penetran la piel, las larvas filariformes alcanzan las vénulas superficiales y migran al torrente sanguíneo hasta el corazón. Al pasar a la circulación pulmonar, atraviesan la pared de los alveolos. Suben luego por el árbol respiratorio y son deglutidos al sistema digestivo y descienden al intestino delgado donde terminan desarrollándose en los adultos.

Patología

El grado de infestación depende de la carga parasitaria. Por los lugares de ingreso producen eritema, vesículas, lesiones que pueden infectarse por bacterias piógenas, lesiones en alveolos pulmonares, hemorragias alveolares y úlceras intestinales.

Profilaxis

Se debe evitar la contaminación fecal del suelo. Mejorar el saneamiento ambiental mediante letrinas, red de alcantarillados, uso de calzados y educación sanitaria.

Necátor americanus

Es un parásito que vive en el intestino delgado de huéspedes como los humanos, cerdos, perros y gatos, produciendo la enfermedad llamada necatoriasis.

Este parásito posee dos placas cortantes dorsales y dos ventrales alrededor del margen anterior de la capsula bucal. Los machos tienen usualmente 7 a 9mm. De longitud. La vida media promedio de estos parásitos oscila entre 3 y 5 años. Pueden producir entre 5000 a 10000 huevos por día.

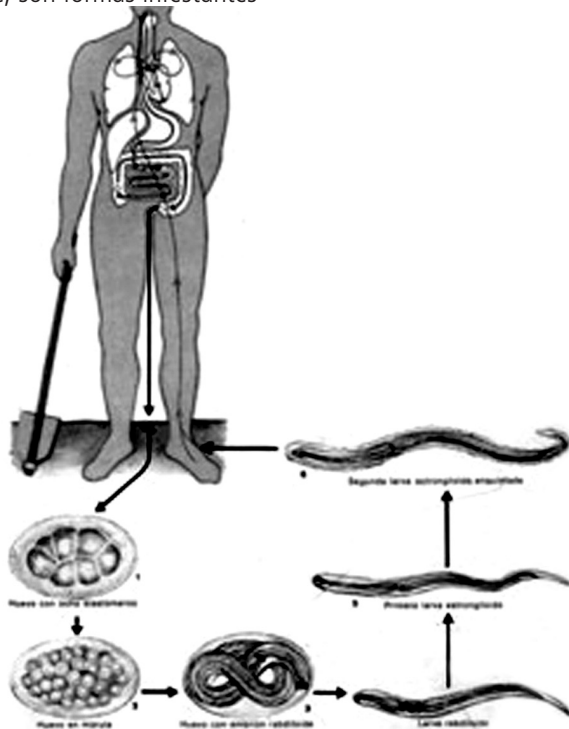
Ciclo de vida

El gusano adulto se origina a partir de un huevo anembrionado en el suelo. Bajo condiciones favorables, después de 24 a 48 horas, los huevos se tornan embrionados y eclosionan.

Las larvas se forman en la tierra de dos tipos:

Larva rhabditiforme: Salen del huevo de la tierra, no son infestantes

Larva filariforme: Se originan de la larva rhabditiforme, son formas infestantes



Esta última forma larvaria es capaz de penetrar la piel humana, migrar por el torrente sanguíneo y alcanzar el pulmón pasando por el ventrículo izquierdo del corazón. Una vez ahí, perforan y penetran la cavidad alveolar y ascienden por la tráquea donde son deglutidos descen-

diendo hasta el intestino delgado. En este sitio maduran y se convierten en adultos asiéndose a la pared intestinal, alimentándose de sangre. Causando en casos severos una disminución significativa de las cifras de hemoglobina al huésped. Los huevos terminan en el suelo, dejando el cuerpo a través de las heces.

Strongyloides Stercoralis

Es un parásito el cual habita la mucosa y las submucosas del intestino delgado, principalmente el duodeno, pero en infecciones masivas puede invadir todo el intestino delgado y grueso, y eventualmente alcanza los conductos pancreáticos y biliar. Sus huevos son muy parecidos a los de la Uncinaria.

La presencia de los huevo en heces es muy rara, solo está presente en casos de diarrea muy intensa.

El macho mide 0.7 mm de longitud por 40um de diámetro, la hembra parasita mide alrededor de 2.2 mm de largo por 20 a 70um de diámetro.

Ciclo de vida

Se presenta 3 formas de ciclo:

Ciclo directo (hembra)

Ciclo indirecto (hembra – macho)

Ciclo autoinfestación (hembra)

Ciclo Directo

Las larvas rhabditiforme caen al suelo en materias fecales, se alimentan y mudan dos veces para transformarse en filariforme.

Estas larvas permanecen en la superficie del suelo esperando el contacto con la piel

Penetran por la piel y llegan al corazón, a los pulmones rompen los alvéolos

Ascienden por los bronquiolos, laringe y llegar a la faringe y ser deglutidas.

En el intestino delgado penetran la mucosa y se convierten en adultos. (1 mes).

Ciclo Indirecto

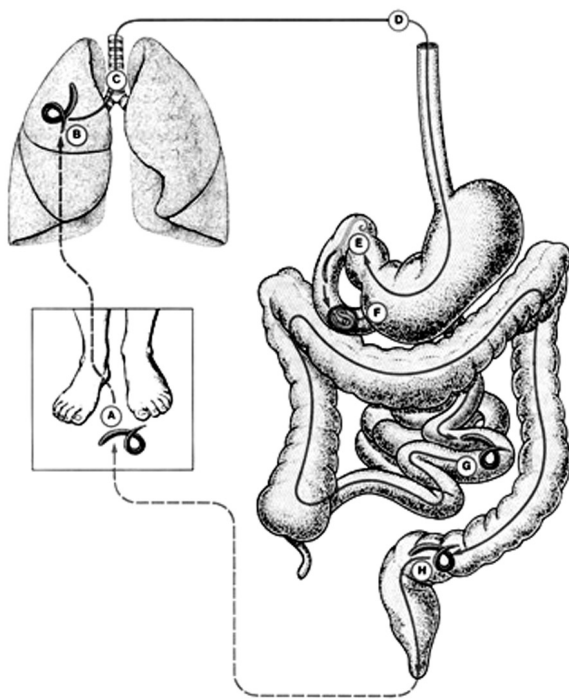
Incluye una o varias generaciones de la larva de vida libre. Son larvas rhabditiforme, en el suelo se transforman en adulto (no infestante).

El macho y hembra copulan y dan origen a huevos que embriónan para producir larvas rhabditiforme y mantener la existencia indefinida en la tierra.

Algunas de las larvas se convierten en filariformes (infestante) que invaden la piel.

Ciclo autoinfección

Sucede cuando las larvas rhabditiformes se transforman en filariformes en la luz del intestino. Estas penetran en la mucosa intestinal, llegan a la circulación y continúan el recorrido descrito en el ciclo directo. La transformación a larvas filariformes puede suceder en la región perianal y allí penetrar a la circulación.



Mebendazol

Este fármaco es un antihelmíntico o también conocido como medicamento anti-lombriz, el cual se encarga de impedir que las lombrices crezcan y se multipliquen en el organismo del huésped, pertenece al grupo de los antihelmínticos derivados del benzimidazol sintético de amplio espectro.

De preferencia se utiliza este fármaco en el tratamiento de enfermedades producidas por helmintos (parásitos del tracto gastrointestinal), impide que el parásito utilice la glucosa, provocando una disminución de la energía y la muerte del parásito.

Farmacocinética

Absorción: después de la administración oral, aproximadamente el 20% de la dosis alcanza la circulación sistémica, a causa de la completa absorción y al metabolismo presistémico amplio. Las concentraciones plasmáticas máximas se observan generalmente entre las 2 y 4 horas, después de la administración.

Distribución: el Mebendazol se enlaza a las proteínas plasmáticas en un 90 a 95%. El volumen de distribución es de 1 a 2 litros/kg, indicando que el Mebendazol penetra en el espacio extravascular.

Metabolismo: el Mebendazol oral se metaboliza primaria y ampliamente en el hígado. Las concentraciones plasmáticas de la mayoría de sus metabolitos (formas amino y amino hidroxiladas) son considerablemente más

altas que las del Mebendazol. Daño en la función hepática, en el metabolismo o en la eliminación biliar pueden inducir niveles plasmáticos elevados de Mebendazol.

Eliminación: el Mebendazol, sus formas conjugadas y su metabolismo probablemente experimentan cierto grado de recirculación entero hepática y se excreta en la orina y en la bilis. La vida media de eliminación después de una dosis oral es de 3 a 6 horas en la mayoría de los pacientes.

Farmacodinamia

El Mebendazol inhibe la síntesis microtubular en los nematodos, deteriorando así, de manera irreversible, la captación de glucosa. Como resultado los parásitos intestinales se inmovilizan o mueren lentamente y es posible que su depuración de las vías gastrointestinales no sea completa sino hasta varios días después del tratamiento. La eficacia del fármaco varía según el tiempo de tránsito gastrointestinal, la intensidad de la infestación y el hecho de que el fármaco se mastique o no.

El Mebendazol está indicado en el tratamiento de:

- Enterobius vermicularis
- Trichuris trichiura
- Ascaris lumbricoides
- Ancylostoma duodenales
- Necator americanus

Migración de las larvas por la piel (larva currens)



Larva Migrans cutánea

Posología

Adultos y adolescentes:

La dosis indicada es de 100mg. 2 veces por día, una toma en la mañana y la otra en la noche, durante 3 días. Si es necesario puede repetirse después de 2 o 3 semanas.

Algunos autores recomiendan utilizar un laxante después de haber tomado el Mebendazol, esto con el fin de elimi-

nar completamente parásitos que quizás quedan adheridos al intestino del humano.

Pediatría:

En niños de hasta 2 años de edad no se ha establecido la dosificación.

Pero ya niños de más de 2 años se les da el Mebendazol también de 100mg. Pero en jarabes para su mejor administración.

Efectos adversos

En general los efectos adversos del Mebendazol son poco frecuentes. Puede producir náuseas, vómitos, dolor abdominal y diarrea.

Raramente puede producir otros efectos como por ejemplo dolor de cabeza, fiebre y erupciones en la piel.

Efervescentes

Un efervescente es una forma farmacéutica provista para ser disuelta o para ser dispensada en agua antes de la administración. Pertenecen al grupo de medicamentos orales.

Contiene generalmente además de el o los principios activos, una mezcla de ácidos o sales ácidas y carbonatos o bicarbonatos los cuales emiten dióxido de carbono cuando están mezclados en agua.

Entonces la efervescencia es la aparición de burbujas de gas en un líquido, como resultado de una reacción química. La reacción más común para propósitos farmacéuticos es la reacción ácido base entre el bicarbonato de sodio y el ácido cítrico. Esta reacción comienza con la presencia de agua, una cantidad pequeña pero uniforme como agente catalítico, acelera la velocidad de reacción, dificultando para la reacción cuando esta ha iniciado. Por esta razón, la fabricación y el almacenaje de los productos efervescentes es planeada reduciendo al mínimo el contacto con el agua.

Ventajas

Los efervescentes poseen una ventaja importante, que la cantidad del fármaco está ya en la solución que se consume en ese momento. Así la absorción es más rápida y más completa que en una tableta convencional. Una absorción más rápida significa un inicio más rápido de la acción.

Los medicamentos efervescentes se administran en forma líquida así que son más fáciles de tomar con respecto a las tabletas o a las capsulas.

Al disolverse completamente en una solución amortiguadora reducen el contacto en la parte superior del aparato gastrointestinal, provocando menos irritación y mayor tolerancia.

Es por eso que tomando en cuenta estas ventajas se ha podido elaborar un antihelmíntico en efervescente accesible a las personas y agradables al momento de su administración.

Desventajas

En algunos casos el sabor puede ser muy desagradable por algunos ingredientes activos que no puedan ser enmascarados por sabores y edulcorantes. Esto conducirá a un producto inaceptable.

METODOLOGIA

Para la elaboración de dicha forma farmacéutica se siguieron los siguientes pasos:

Uso del material de laboratorio:

- Mortero
- Balanzas
- Espátula
- Varilla
- Vasos de precipitación
- Tamiz
- Bolsas plásticas
- Máquina selladora de plásticos
- Papel aluminio
- Etiquetas

MATERIAS PRIMAS

- Mebendazol (principio activo)
- Bicarbonato de sodio
- Ácido cítrico
- Azúcar
- Esencia
- Colorante
- Benzoato de sodio

PROCEDIMIENTO

- Limpieza del todo el material
- Pesar cada una de las materias primas
- Tamizar
- Mezclar
- Dosificar
- Acondicionar
- Sellar

Condiciones ambientales que provocan parasitosis

Letrinas en zonas rurales

Contacto directo de los pies con la tierra

Consecuencias de una parasitosis

Puede provocar anemias agudas

Rechazo a la alimentación

BIBLIOGRAFÍA (Resumen)

SERRANO ALONSO MARIA Departamento de Farmacia Clínica Universidad de Navarra

KATZUNG B. Farmacología básica y clínica. 7ma ed. México DF. Manual Moderno; 1999. pg. 997-999.

GUAMERA, E. 2004. Parásitos en el hombre. Instituto Nacional de enfermedades infecciosas. Argentina.

ORGANIZACIÓN MUNDIAL DE LA SALUD. 2005. Prevención y control de esquistosomiasis y las geohelmintiasis. Ginebra.

www.aisnicaragua.org/download/bronline/tercera/395.pdf

<http://www.galeno21.com/INDICE%20FARMACOLOGICO/MEBENDAZOL/articulo.htm>

<http://www.indicadedrogas.com.ar/mebendazol.htm>

<http://www.salud.es/principio/mebendazol>

<http://antihelminticos.wordpress.com/>