

Parámetros Farmacocinéticos en el Estado Estacionario de una Formulación de Teofilina de Acción Sostenida

Arlette LINARES BORGES ^{1*}, Jesús M. RODRÍGUEZ MUÑÍZ ², Higinio ALEMÁN AGUILAR ³,
Jorge H. SUARDÍAZ PARERAS ⁴, Esther GONZÁLEZ PORTO ⁴,
Lizet BONET ROSELLÓ ⁴ y Laura DE LA VEGA ELÍAS ²

¹ Instituto Superior de Ciencias Médicas, Apartado # 860, Santa Clara, Villa Clara, Cuba.

² Hospital Provincial Docente Clínico Quirúrgico, Santa Clara.

³ Hospital Docente Clínico Quirúrgico Manuel Fajardo Rivero, Santa Clara.

⁴ Hospital Docente Clínico Quirúrgico "Hnos Ameijeiras", La Habana.

RESUMEN. Se determinaron los parámetros farmacocinéticos en el estado estacionario (C^{∞}_{\max}), (T_{\max}) (C^{∞}_{\min}), ($ABC_{0-\tau}$) y concentración de la formulación en el estado estacionario (C_{∞}) calculada como (ABC/τ) en 10 pacientes asmáticos moderados o severos, que recibían tratamiento en intercrisis con teofilina de liberación sostenida Aristegui 300 mg, a la dosis de 9 mg/kg de peso/día (cada 12 horas). Se comprobó a partir de los resultados que la administración de la formulación de teofilina retard Aristegui 300 mg a la dosis empleada fue suficiente para mantener niveles séricos del fármaco dentro del rango terapéutico durante el intervalo de dosificación.

SUMMARY. "Steady state pharmacokinetic parameters of a slow release theophylline formulation". Steady state pharmacokinetic parameters were determined in 10 moderate or severe asthmatic patients who received inter-crisis treatment with slow release theophylline (Aristegui 300 mg, 9 mg per kg of body weight per day). Aristegui 300 mg theophylline administration was able to maintain blood levels in the therapeutic range during dosification interval.

INTRODUCCIÓN

La teofilina (1,3 dimetilxantina) es un alcaloide con baja solubilidad en agua, similar en estructura química a la cafeína y la teobromina. De todas sus acciones moleculares, su habilidad para inhibir la fosfodiesterasa de nucleótidos cíclicos y para antagonizar las acciones de la adenosina sobre sus receptores, son las mejor caracterizadas ¹.

El paciente asmático, moderado o severo, precisa utilizar teofilina para controlar sus síntomas ², pero cuando se piensa en prescribirla, es difícil no preguntarse ¿qué dosis, con qué frecuencia y durante qué tiempo administrarla?; en la práctica, muchas veces las dosis recomendadas no conducen al éxito terapéutico, pues en ocasiones son insuficientes y en otras tóxicas.

Los parámetros farmacocinéticos establecidos para un principio activo pueden alterarse por la amplia variación interindividual; ésta es responsable, en gran parte, de la variación de estos parámetros y de la respuesta terapéutica final ³,

fundamentalmente en tratamientos con drogas como la teofilina.

Los preparados de teofilina de liberación sostenida muestran un perfil farmacocinético más favorable, una biodisponibilidad oral que puede o no alterarse por la ingestión de alimentos ¹, un tiempo de vida media más prolongado y menores fluctuaciones en las concentraciones séricas durante el día por proveer una absorción y una liberación más lenta y continua, con mejor tolerancia ⁴. Proporcionan además un efecto terapéutico más sostenido cuando la droga alcanza el estado estacionario, lo que reduce sobre todo los síntomas de asma nocturna ⁵, el riesgo de ataques de asma temprana ⁶ y la incidencia de efectos adversos; por ello, se prefieren a los preparados estándar en el control de síntomas del paciente asmático, una vez que no se le ha controlado con beta₂ agonistas o antiinflamatorios inhalatorios, por las grandes fluctuaciones que entre las concentraciones máximas y mínimas se presentan con el uso de los mismos.

PALABRAS CLAVE: Farmacocinética, Teofilina de acción sostenida, Dosis.

KEY WORDS: Pharmacokinetics, Slow release theophylline, Doses.

* Autor a quien dirigir la correspondencia. Email: arlet@ cubanicay.vcl.sld.cu