

# Administración de medicamentos por vía rectal



Tema 8

# Índice de contenidos

---

- ❑ Introducción
- ❑ Fármacos administrados por vía rectal
- ❑ Características anatómo-fisiológicas del recto
- ❑ Mecanismos de absorción rectal
- ❑ Factores que afectan a la absorción rectal
- ❑ Formas farmacéuticas de administración rectal
- ❑ Disposición de fármacos a partir de supositorios
- ❑ Influencia de la formulación en la absorción rectal
- ❑ Estrategias para mejorar la absorción rectal
- ❑ Ventajas e inconvenientes
- ❑ Métodos de estudio de la absorción rectal

# Introducción

---

Alternativa para:

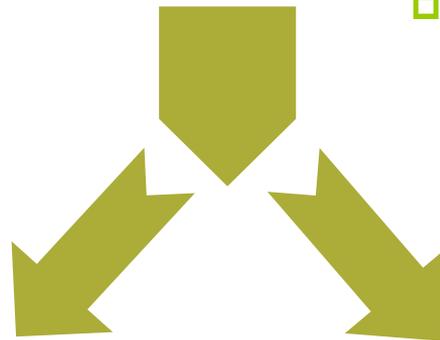
## ■ PACIENTES:

- Náuseas
- Cirugía
- Post-operatorio
- Problemas de deglución
- Niños, ancianos, enfermos mentales

## ■ PRINCIPIO ACTIVO:

- Irritación local
- Fármaco inestable
- Fármacos que sufren efecto de primer paso hepático
- Sabor desagradable

Efecto local



Efecto sistémico

# Fármacos administrados por vía rectal

---

## EFEECTO LOCAL

---

---

Laxantes

glicerina  
aceite mineral

---

Antihemorroidales

hidrocortisona  
dibucaína  
proxamina

---

Colitis, proctitis

belladona  
mesalamina

---

Diarrea enteropatogénica neomicina

---

Agentes de contraste

sulfato de bario  
diatrizoato

---

---

# Fármacos administrados por vía rectal

---

## EFEECTO SISTÉMICO

Antihistamínicos	prometazina
Antimigrañosos	ergotamina
AINES	ac. acetilsalicílico indometacina
Analgésicos	morfina opio paracetamol
Tranquilizantes	clorpromacina
Broncodilatadores	teofilina
Antieméticos	trimetobenzamida

# Anatomía y fisiología del recto

---

## 1. ANATOMÍA

- Ampolla rectal: 12 cm

### líquido rectal:

1-3 ml

pH 6-8

viscoso (mucina)

poca capacidad tamponante

- Conducto anal: 3 cm

## 2. HISTOLOGÍA

- No hay capa serosa
- Muscular
- Submucosa: plexo venoso
- Mucosa: sin vellosidades ni microvellosidades  
uniones más estrechas  
menor número de transportadores que el intestino delgado

# Anatomía y fisiología del recto

---

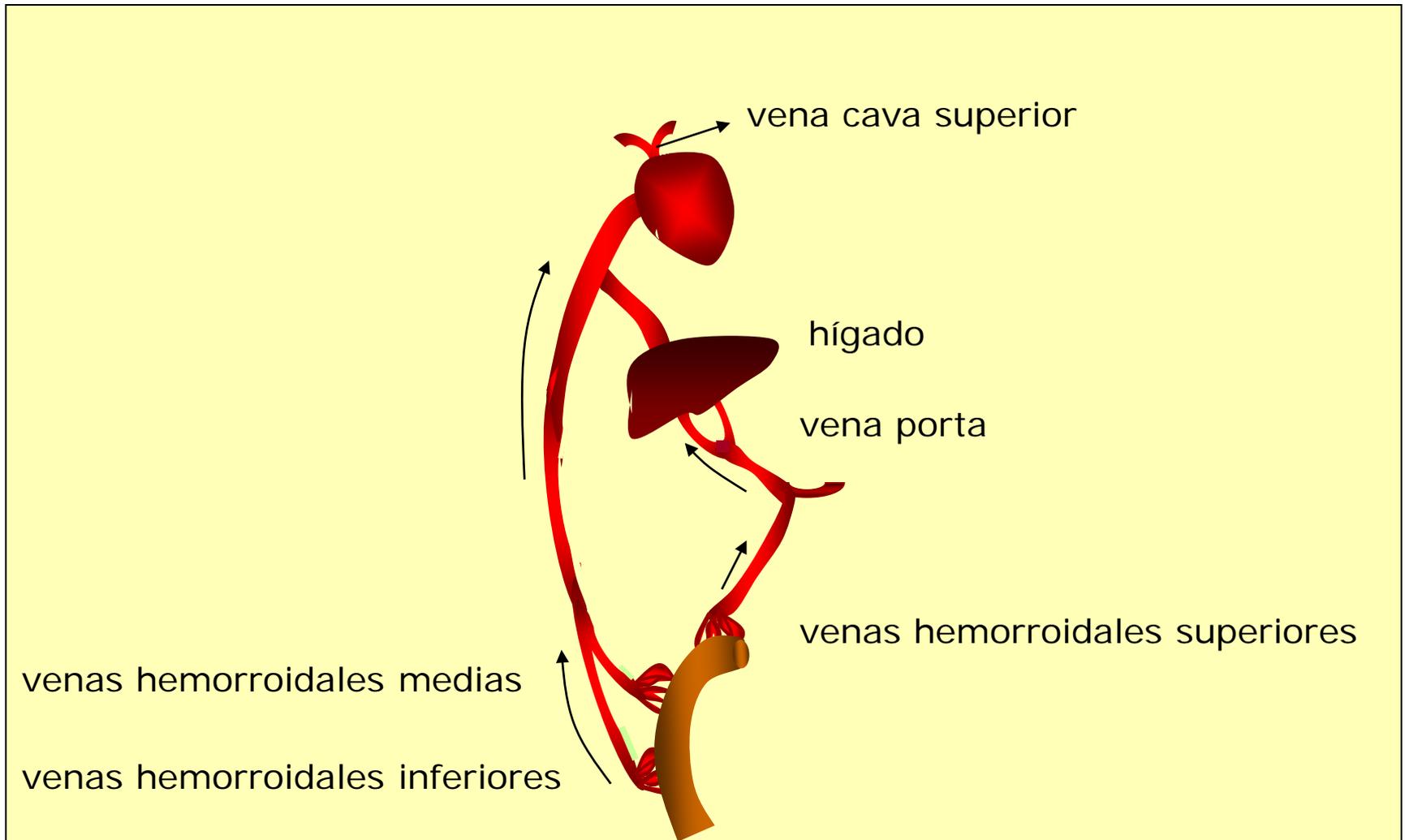
## 3. VASCULARIZACIÓN

- Venosa: venas hemorroidales:
  - superiores → hígado
  - Medias e inferiores → circulación general
- Linfática

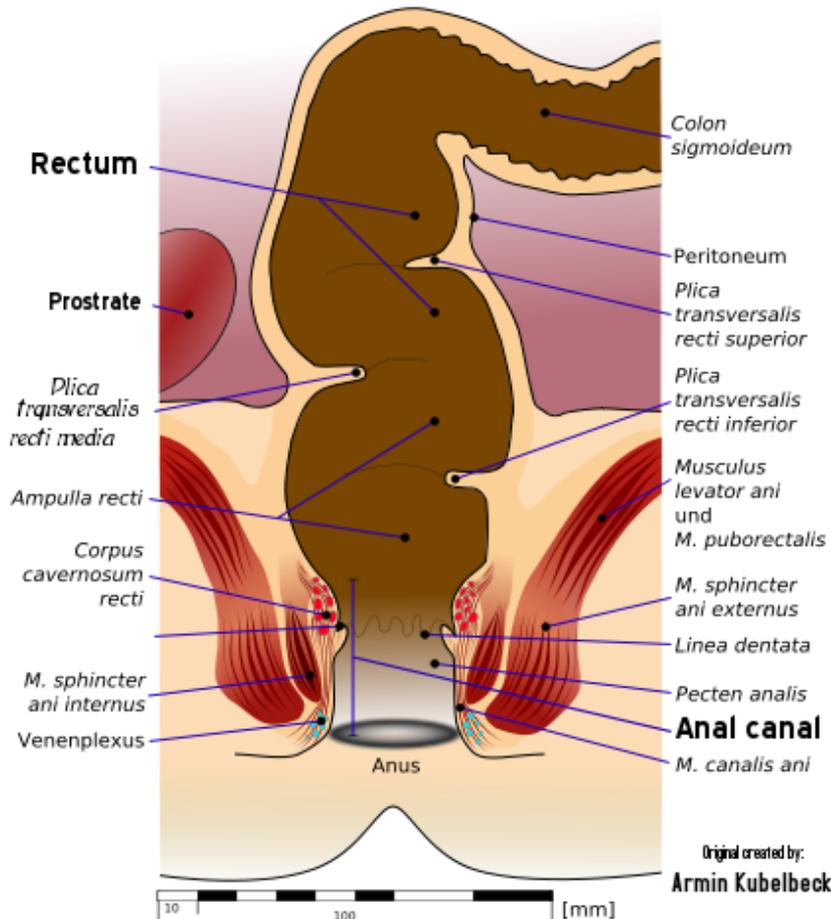
## 4. FISIOLÓGÍA

- Secreciones: menor contenido de enzimas proteolíticas

# Anatomía y fisiología del recto



# Anatomía y fisiología del recto



Armin Kubelbeck. Publicada en Wikimedia Commons con licencia Creative Commons Attribution/Share-Alike License 2.5 License 2006 .  
[http://commons.wikimedia.org/wiki/File:Rectum\\_anatomy\\_de\\_01.svg](http://commons.wikimedia.org/wiki/File:Rectum_anatomy_de_01.svg)

# Mecanismos de absorción rectal

---

1. Difusión pasiva
2. Transporte paracelular
3. Transporte mediante transportadores

# Factores que afectan a la absorción rectal

---

## 1. Fisiológicos:

1. Cantidad de fluido rectal
2. pH del fluido rectal
3. Viscosidad del fluido rectal
4. Superficie de absorción
5. Tiempo de retención
6. Contenido fecal (enemas laxantes)
7. Irrigación sanguínea

## 2. Físico-químicos:

1. Peso molecular
2. Coeficiente de reparto
3. Solubilidad
4. pKa

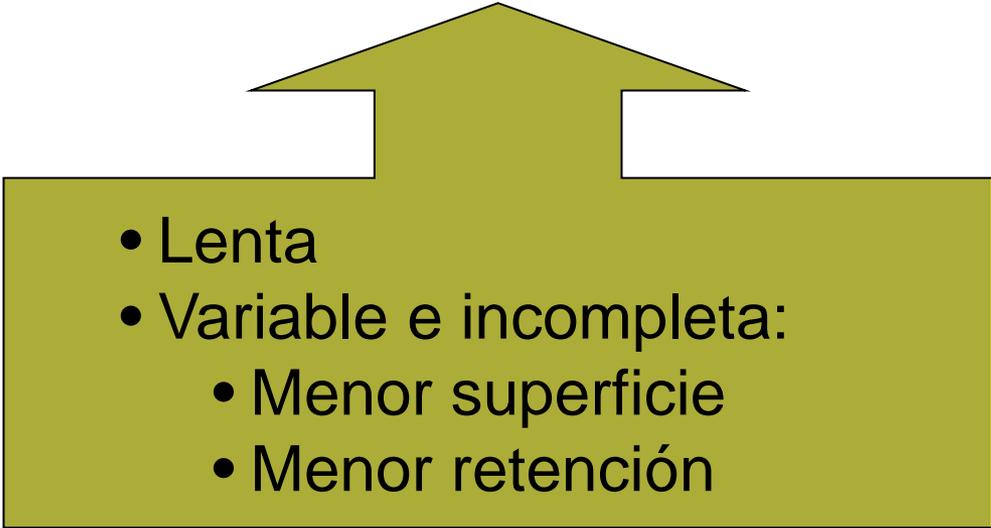
## 3. Formulación:

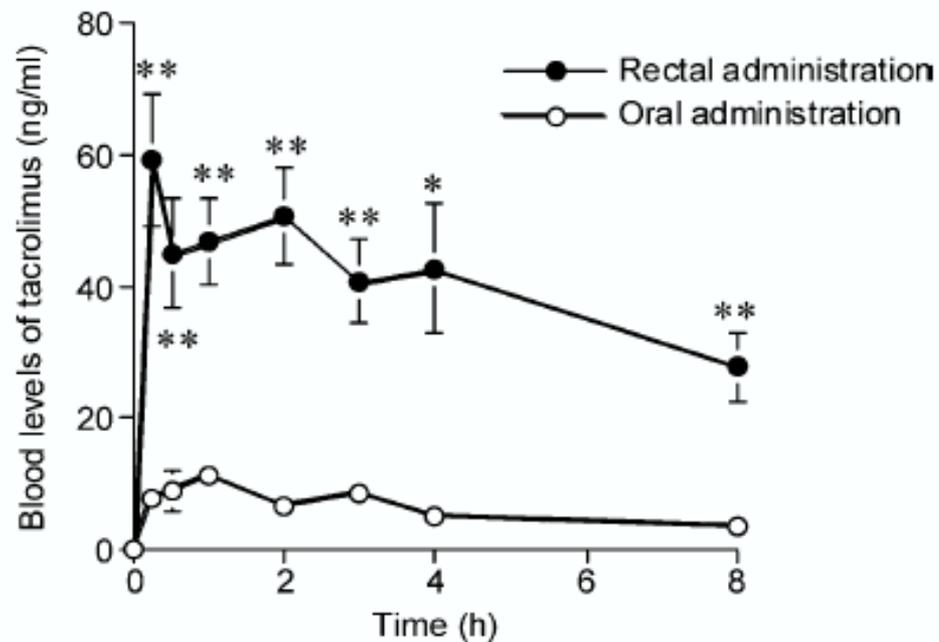
1. pH
2. Interacciones con el excipiente
3. Viscosidad de los excipientes

# Absorción

---

## ABSORCIÓN

- 
- Lenta
  - Variable e incompleta:
    - Menor superficie
    - Menor retención



Whole Blood Concentration–Time Curves of Tacrolimus after Rectal and Oral Administration to Rats

Saka M, Hobara N, Hokama N, Kameya H, Ohshiro S, Sakanashi M, Sarroh H. *Biol Pharm Bull* 2004; 27:1480-1482

# Formas Farmacéuticas de Administración Rectal

---

## 1. **SUPOSITORIOS**

- Las más utilizadas (98%)
  - Acción mecánica (glicerina)
  - Acción local (antihemorroidal)
  - Acción sistémica (paracetamol)

## 2. **CAPSULAS RECTALES** (supositorios encapsulados)

## 3. **SOLUCIONES, EMULSIONES Y SUSPENSIONES RECTALES**

- Volumen: 2,5 mL a 2 L
- Acción local o sistémica
- Uso en diagnóstico

## 4. **POLVOS Y COMPRIMIDOS PARA SOLUCIONES O SUSPENSIONES RECTALES**

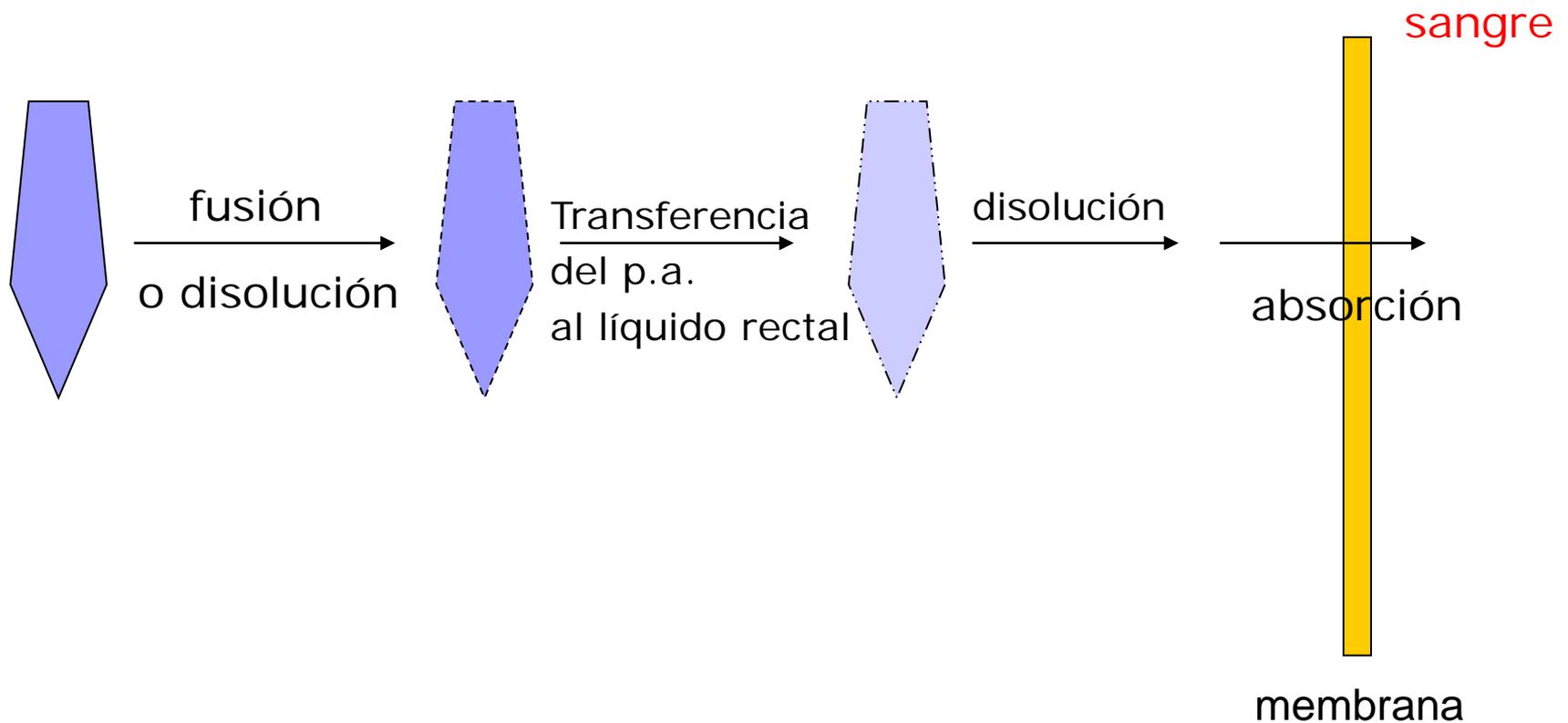
## 5. **PREPARACIONES RECTALES SEMISÓLIDAS**

- Geles
- Cremas
- Pomadas

## 6. **ESPUMAS RECTALES**

## 7. **TAMPONES RECTALES**

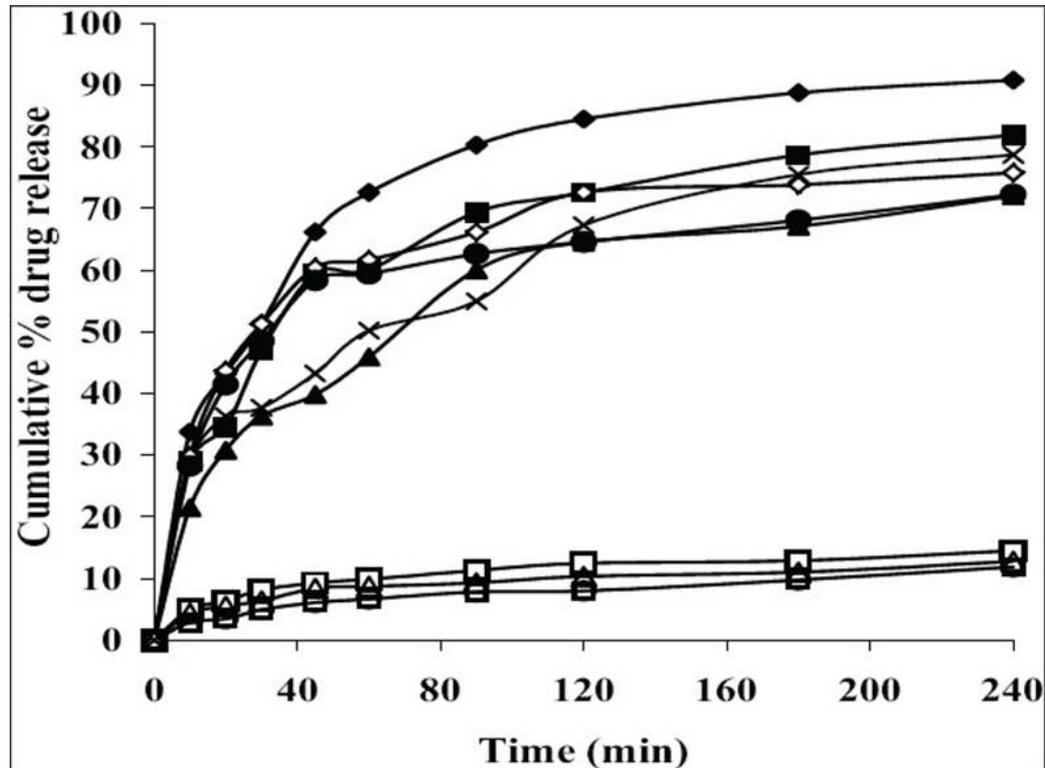
# Disposición de principios activos a partir de supositorios



# Disposición de principios activos a partir de supositorios

	<b>Fármaco</b>	<b>Excipiente</b>
1. Solución acuosa del p.a.	soluble	hidrófilo
2. Solución y suspensión acuosa del p.a.	parcialmente soluble	hidrófilo
3. Emulsión o/w con p.a. en solución en w	soluble	graso
4. Emulsión o/w con p.a. en suspensión en w	parcialmente soluble	graso
5. Suspensión acuosa del pa	insoluble	hidrófilo
6. Emulsión w/o con p.a. en solución en w	soluble	graso
7. Emulsión con p.a. en la fase oleosa	lipófilo	graso

# Disposición de principios activos a partir de supositorios



Liberación de tramadol a partir de supositorios preparados con diferentes excipientes

Saleem MA, Taher M, Sanaullah, Najmuddin M, JAved A, Humaira S, Soshan S. *Indian J Pharm Sci* 2008;70: 640-644

# Influencia de la formulación en la absorción rectal

---

- ❖ Rapidez:
  - Solución > supositorios
- ❖ Viscosidad (difusión del p.a.)
- ❖ Extensibilidad (efecto de primer paso hepático)
- ❖ Retención

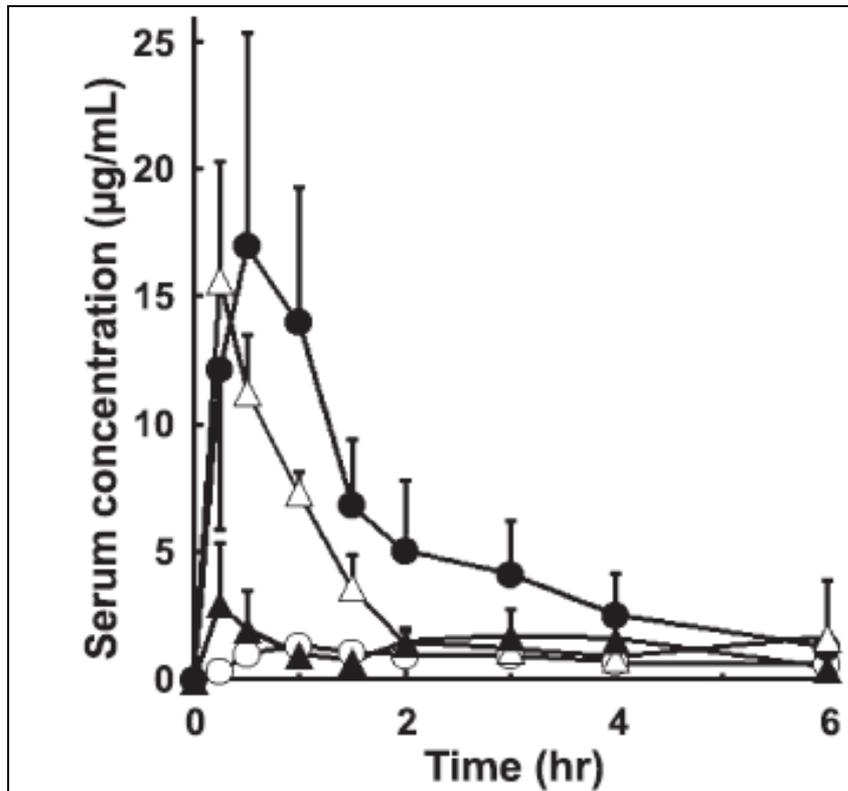


# Estrategias para mejorar la absorción rectal

---

1. Promotores de la absorción:
  1. Acilcarnitinas
  2. Acilcolinas
  3. Sales biliares
  4. Salicilatos
  5. Derivados de ácidos grasos
2. Control del pH
3. Modificadores de la viscosidad

# Estrategias para mejorar la absorción rectal



- O: control
- : laurato sódico
- △ : laurato + taurina
- ▲ : laurato + L-glutamina

Niveles plasmáticos de rebamipida tras su administración en forma de supositorios a ratas por vía rectal.

# Ventajas e inconvenientes de la administración rectal

---

## **VENTAJAS**

1. Estabilidad
2. Disminución del efecto de primer paso hepático
3. Mayor capacidad de dosificación

## **INCONVENIENTES**

1. Variabilidad
2. Baja aceptación y cumplimiento por parte de los pacientes
3. Complejidad de las formulaciones
4. Coste

# Métodos de estudio de la absorción rectal

---

## 1. In vitro:

1. Celdas de difusión
2. Cultivos celulares

## 2. In vivo:

### 1. Rata:

- Solución o suspensión (0,25 mL)
- Microsupositorios

### 2. Conejo:

- Posible sobreestimación

### 3. Perro beagle:

- Microenema (5 mL)
- Supositorios (2,6 g)
- Predecir el comportamiento en humano