

# Ondeste-bideko farmakoen administrazioa



8. gaia

# Edukien indizea

---

- ❑ Sarrera
- ❑ Ondeste bidetik administratutako farmakoak
- ❑ Ondestearen ezaugarri anatomo-fisiologikoak
- ❑ Xurgapen mekanismoak ondostean
- ❑ Ondesteko xurgapena baldintzatzen duten faktoreak
- ❑ Ondeste bidetik administratzeko forma farmazeutikoak
- ❑ Supositorioetan administratutako farmakoen dispozizioa
- ❑ Formulazioaren eragina ondesteko xurgapenean
- ❑ Ondesteko xurgapena hobetzeko estrategiak
- ❑ Abantailak eta desabantailak
- ❑ Ondesteko xurgapena ikasteko metodoak

# Sarrera

---

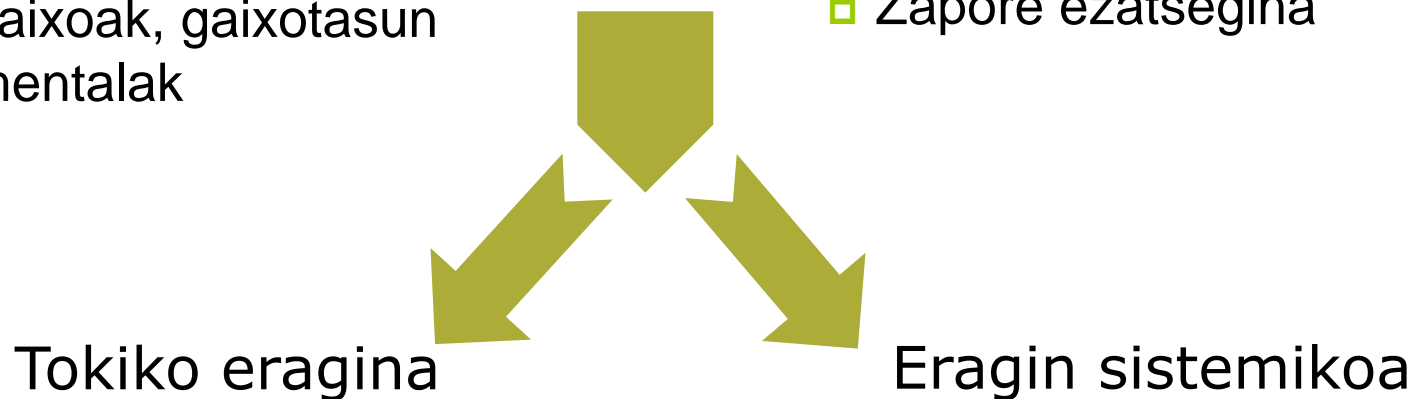
## Egoera hauetan administrazio-bide alternatiboa

### ■ GAI XOAK:

- Goragaleak
- Kirurgia
- Ebakuntza-ostekoa
- Irensteko arazoak
- Haurrak, adineko gaixoak, gaixotasun mentalak

### ■ OSAGAI AKTIBOA:

- Tokiko narritadura
- Farmako ezegonkorra
- Gibelego lehen iragaite efektua jasaten duten farmakoak
- Zapore ezatsegina



# Ondeste bidetik administratutako farmakoak

---

## TOKIKO ERAGINA

Laxanteak	glizerina olio minerala
Hemorroide-kontrakoak	hidrokortisona dibukaina proxamina
Kolitisa, proktitisa	belladona mesalamina
Beherako enteropatogenikoa	neomizina
Kontrasterako sustantziak	bario sulfatoa diatrizoato

# Ondeste bideetik administratutako farmakoak

---

## ERAGIN SISTEMIKOA

Antihistaminikoak	prometazina
Migrainaren kontrakoak	ergotamina
AIEE	az. azetilsalizilikoa indometazina
Analgesikoak	morfina opio paracetamol
Lasaigarriak	klorpromazina
Bronkodilatatzaileak	teofilina
Antiemetikoak	trimetobenzamida

# Ondestearen ezaugarri anatomo-fisiologikoak

---

## 1. ANATOMIA

- Ondesteko anpuluak: 12 cm

ondesteko likidoak:

1-3 ml

pH 6-8

lindirgatsua (muzina)

gaitasun indargetzaile baxua

- Ondeste-hodia: 3 cm

## 2. HISTOLOGIA

- Ez dago geruza serosorik
- Muskularra
- Submukosa: zain-plexua
- Mukosa: Biloxka edo mikrobiloxkarik ez  
Loturak estuagoak  
Heste meharrean baino garraiatzaile gutxiago

# Ondestearen ezaugarri anatomo-fisiologikoak

---

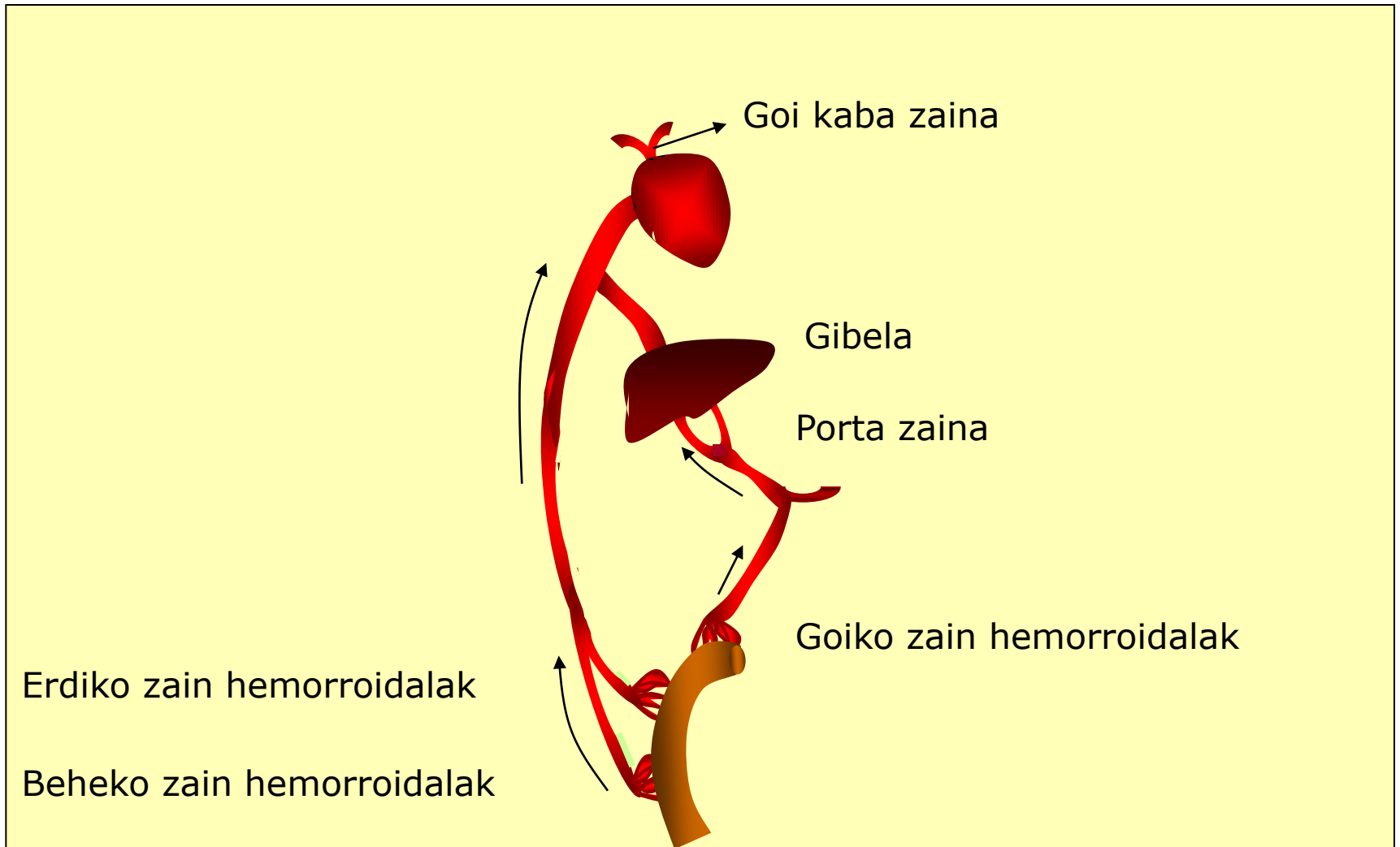
## 3. BASKULARIZAZIOA

- Zaintsua: zain hemorroidalak:
  - goikoak → gibela
  - erdikoak eta behekoak → zirkulazio orokorra
- Linfatikoa

## 4. FISILOGIA

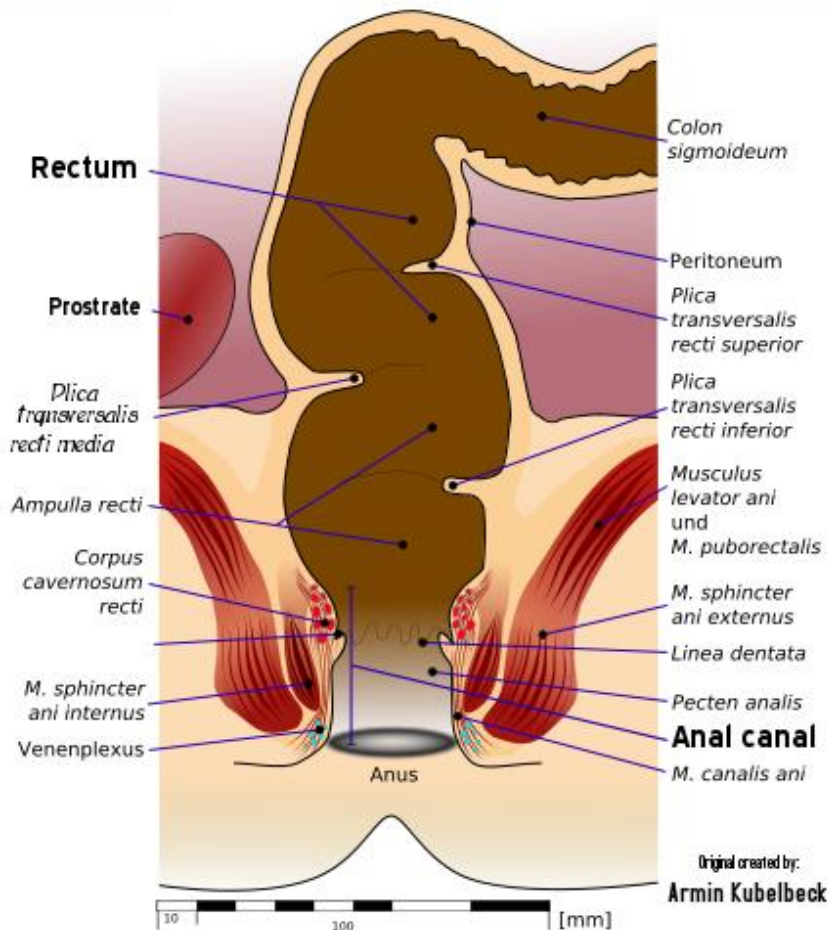
- Jariakinak: entzima proteolitikoen eduki baxuagoa

# Ondestearen ezaugarri anatomo-fisiologikoak





# Ondestearen ezaugarri anatomo-fisiologikoak



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

# Xurgapen mekanismoak ondestean

---

1. Barreiadura pasiboa
2. Garraio parazelularra
3. Garraiatzaile bidezko garraioa

# Ondesteko xurgapena baldintzatzen duten faktoreak

---

## 1. Fisiologikoak:

1. Ondesteko fluxu kantitatea
2. Ondesteko fluxuaren pHa
3. Ondesteko fluxuaren biskositatea
4. Xurgapen azalera
5. Erretentzio-denbora
6. Eduki fekala (enema laxanteak)
7. Odol irrigazioa

## 2. Fisiko-kimikoak:

1. Pisu molekularra
2. Banatze koefizientea
3. Disolbagarritasuna
4. pKa

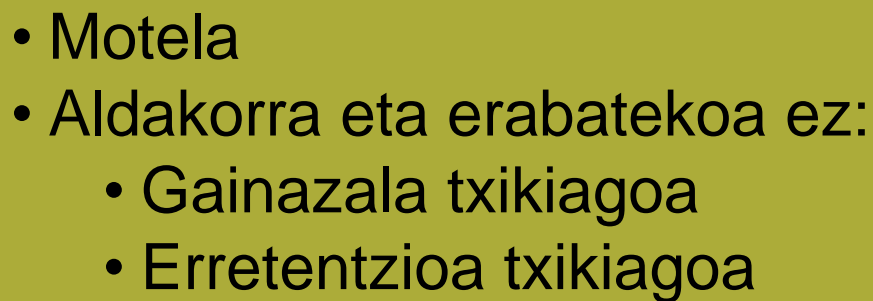
## 3. Formulazioa:

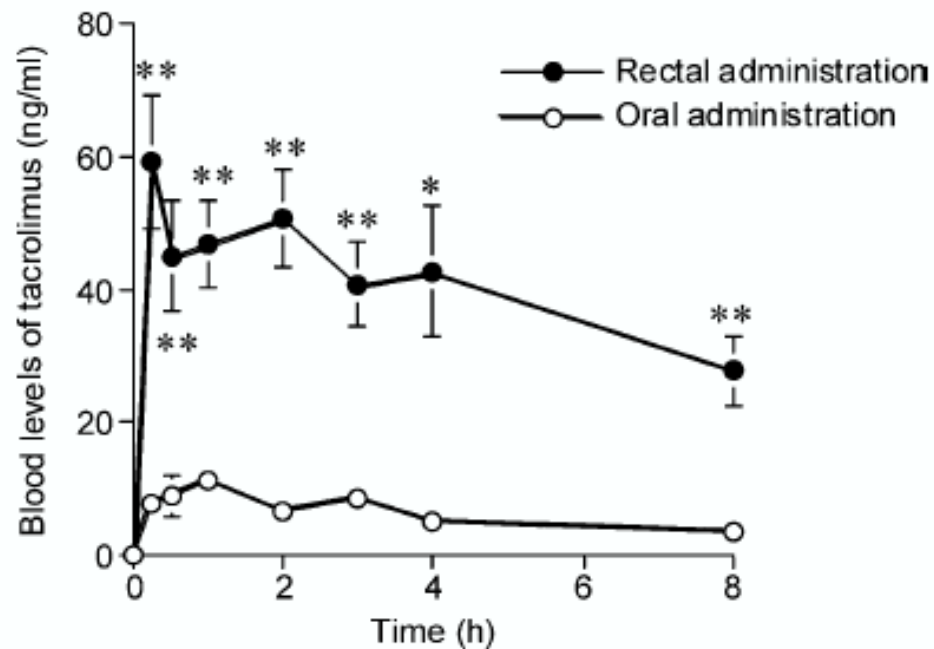
1. pH
2. Eszipientearekin elkarrekintzak
3. Eszipienteen biskositatea

# Xurgapena

---

## XURGAPENA

- 
- Motela
  - Aldakorra eta erabatekoa ez:
    - Gainazala txikiagoa
    - Erretentzioa txikiagoa



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

# Ondeste bidetik administratzeko forma farmazeutikoak

---

## 1. SUPOSITORIOAK

- Erabilienak (98%)
  - Eragin mekanikoa (glizerina)
  - Tokiko eragina (antihemorroidala)
  - Eragin sistemikoa (parazetamol)

## 2. ONDESTEKO KAPSULAK (kapsulatutako supositorioak)

## 3. DISOLUZIOAK, EMULTSIOAK ETA ESEKIDURAK

- Bolumena: 2,5 mL - 2 L
- Tokiko eragina edo sistemikoa
- Diagnostikorako erabili

## 4. ONDESTEKO DISOLUZIOETARAKO EDO ESEKIDURETARAKO HAUTSAK ETA KONPRIMITUAK

## 5. PRESTAKIN ERDISOLIDOAK

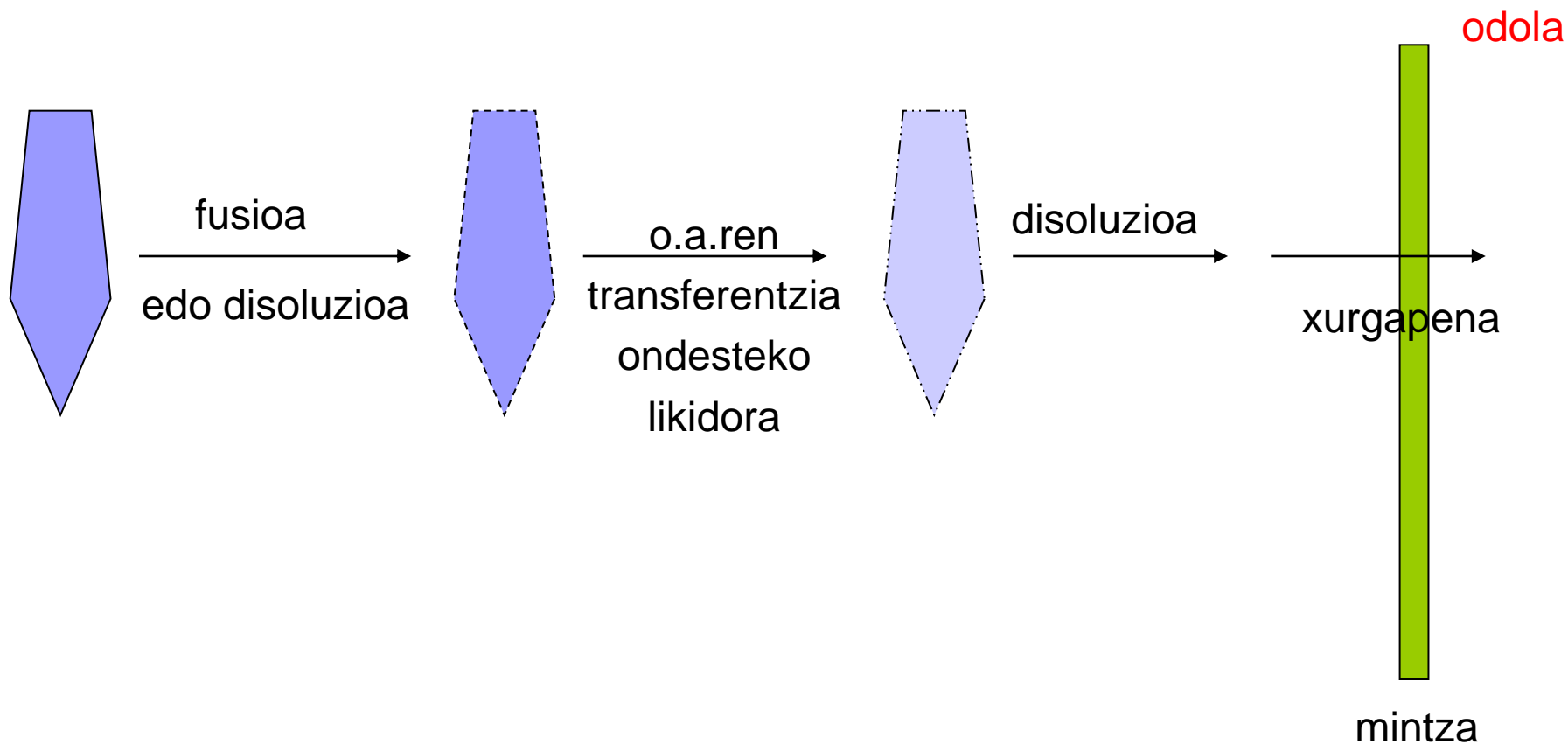
- Gelak
- Kremak
- Pomadak

## 6. ONDESTEKO APARRAK

## 7. ONDESTEKO TANPOIAK

# Supositorioetan administratutako farmakoen disposizioa

---

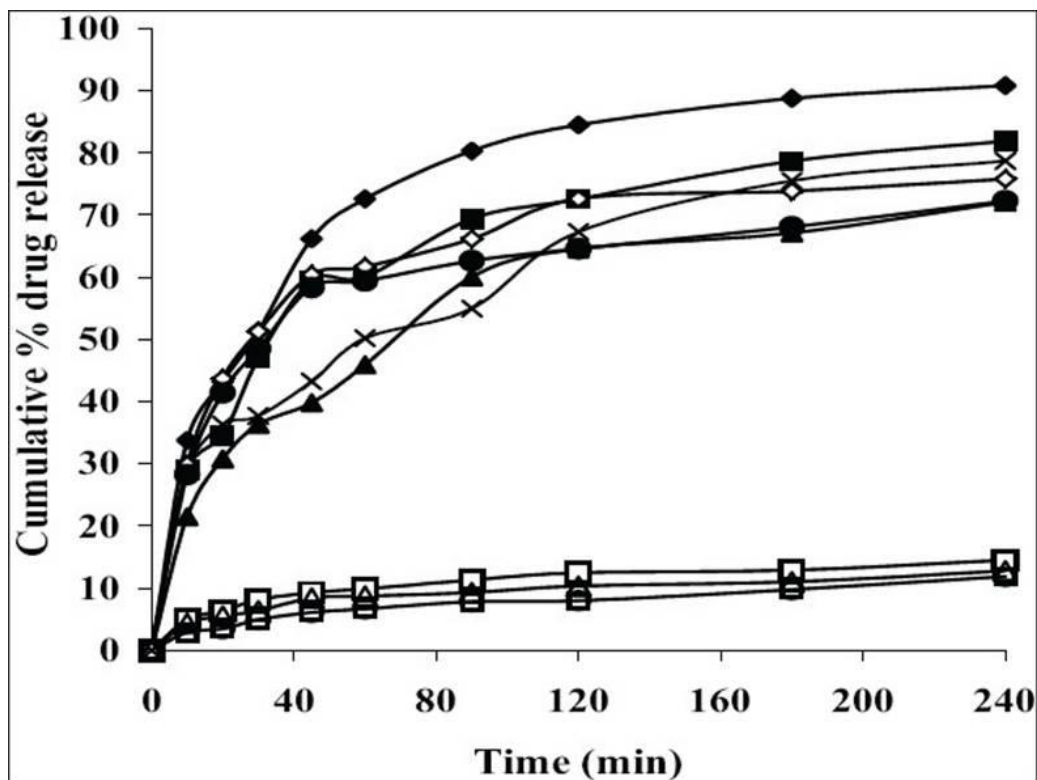


# Supositorioetan administratutako farmakoen dispozizioa

	<b>Farmakoa</b>	<b>Eszipientea</b>
1. O.a-ren disoluzio urtsua	disolbagarria	hidrofiloa
2. O.a-ren disoluzio eta esekidura urtsua	partzialki disolbagarria	hidrofiloa
3. o/w emulsioa, farmakoa w-n disolbaturik	disolbagarria	koipetsua
4. o/w emulsioa, farmakoaren esekidura w-n	partzialki disolbagarria	koipetsua
5. o.a-ren esekidura urtsua	disolbaezina	hidrofiloa
6. w/o emulsioa, farmakoa w-n disolbaturik	disolbagarria	koipetsua
7. Emulsioa, o.a. fase oliotsuan	lipodisolbagarria	koipetsua



# Supositorioetan administratutako farmakoen disposizioa



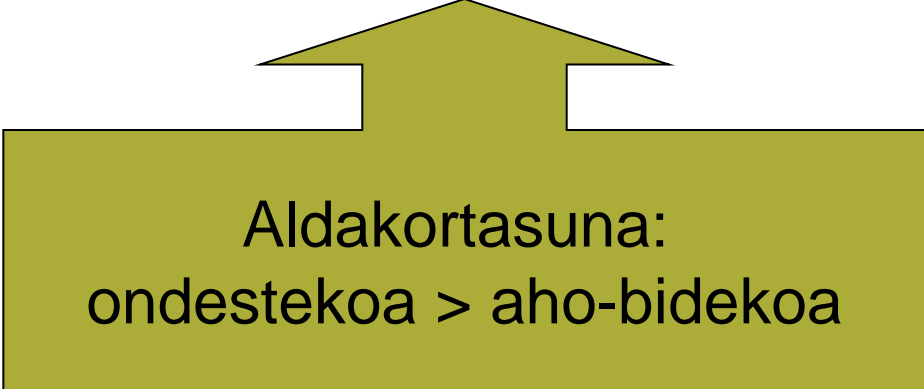
Tramadol farmakoaren askapena eszpiante ezberdinekin prestatutako supositorioetatik

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

# Formulazioaren eragina ondesteko xurgapenean

---

- ❖ Azkartasuna:
  - Disoluzioa > supositorioak
- ❖ Biskositea (o.a-ren barreadura)
- ❖ Hedagarritasuna (gibealeko lehen iragaite efektua)
- ❖ Erretentzioa



Aldakortasuna:  
ondestekoa > aho-bidekoa

# Ondesteko xurgapena hobetzeko estrategiak

---

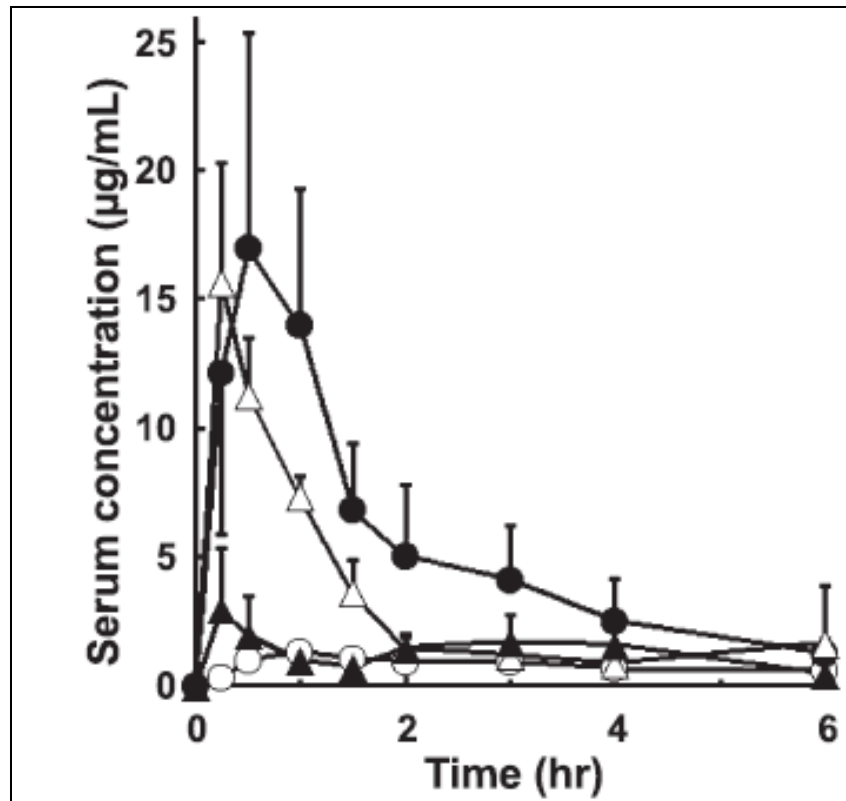
## 1. Xurgapenaren sustatzaileak:

1. Azilkarnitinak
2. Azilkolinak
3. Behazun gatzak
4. Salizilatoak
5. Gantz azidoen eratorriak

## 2. pH-ren kontrola

## 3. Biskositate-aldatzaileak

# Ondesteko xurgapena hobetzeko estrategiak



- O: kontrola
- : laurato sodikoa
- △ : laurato + taurina
- ▲ : laurato + L-glutamina

Rebamipidaren kontzentrazio plasmaticoak supositorioetan arratoiei ondeste bidetik administratu ondoren.

# Abantailak eta desabantailak

---

## ABANTAILAK

1. Egonkortasuna
2. Gibelesko lehen iragaite efektua baxuagoa
3. Dosifikazio gaitasun handiagoa

## DESABANTAILAK

1. Aldakortasuna
2. Gaixoen onarpen eta betetze baxua
3. Formulazioa konplexutasuna
4. Kostua

# Ondesteko xurgapena ikasteko metodoak

---

## 1. In vitro:

1. Barreiadura gelaxkak
2. Zelula-kulturak

## 2. In vivo:

### 1. Arratoia:

- Disoluzioa edo esekidura (0,25 mL)
- Mikrosupositorioak

### 2. Untxia:

- Gainestimazioa eman daiteke

### 3. Beagle txakurra :

- Mikroenema (5 mL)
- Supositorioak (2,6 g)
- Gizakietan portaera aurreikusteko