



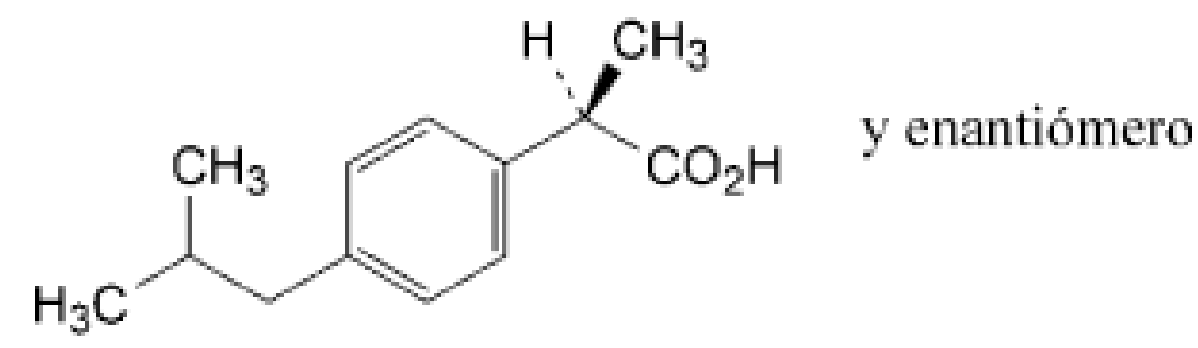
# INNOVACIÓN INCREMENTAL DE INTERÉS TERAPÉUTICO: FORMAS FARMACÉUTICAS CON EL ACTIVO IBUPROFENO

Begoña Wesolowski Valle. Facultad de Farmacia. Universidad Complutense de Madrid. Junio 2020.

## INTRODUCCIÓN

### ¿Qué es el ibuprofeno?

Antiinflamatorio no esteroideo (AINE), quiral, con efecto antiinflamatorio, analgésico y antipirético.



### ¿Cuál es su mecanismo de acción?

Inhibición no selectiva y reversible de las isoenzimas ciclooxigenasas (COX-1 y COX-2), que son responsables de la conversión del ácido araquidónico a prostaglandinas, que juegan un papel clave en la pirexia (fiebre), inflamación y dolor.

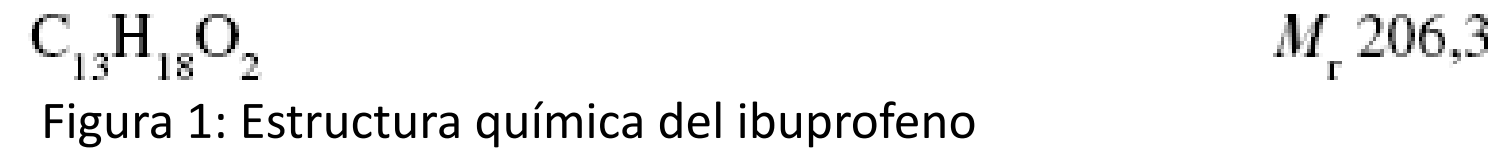


Figura 1: Estructura química del ibuprofeno

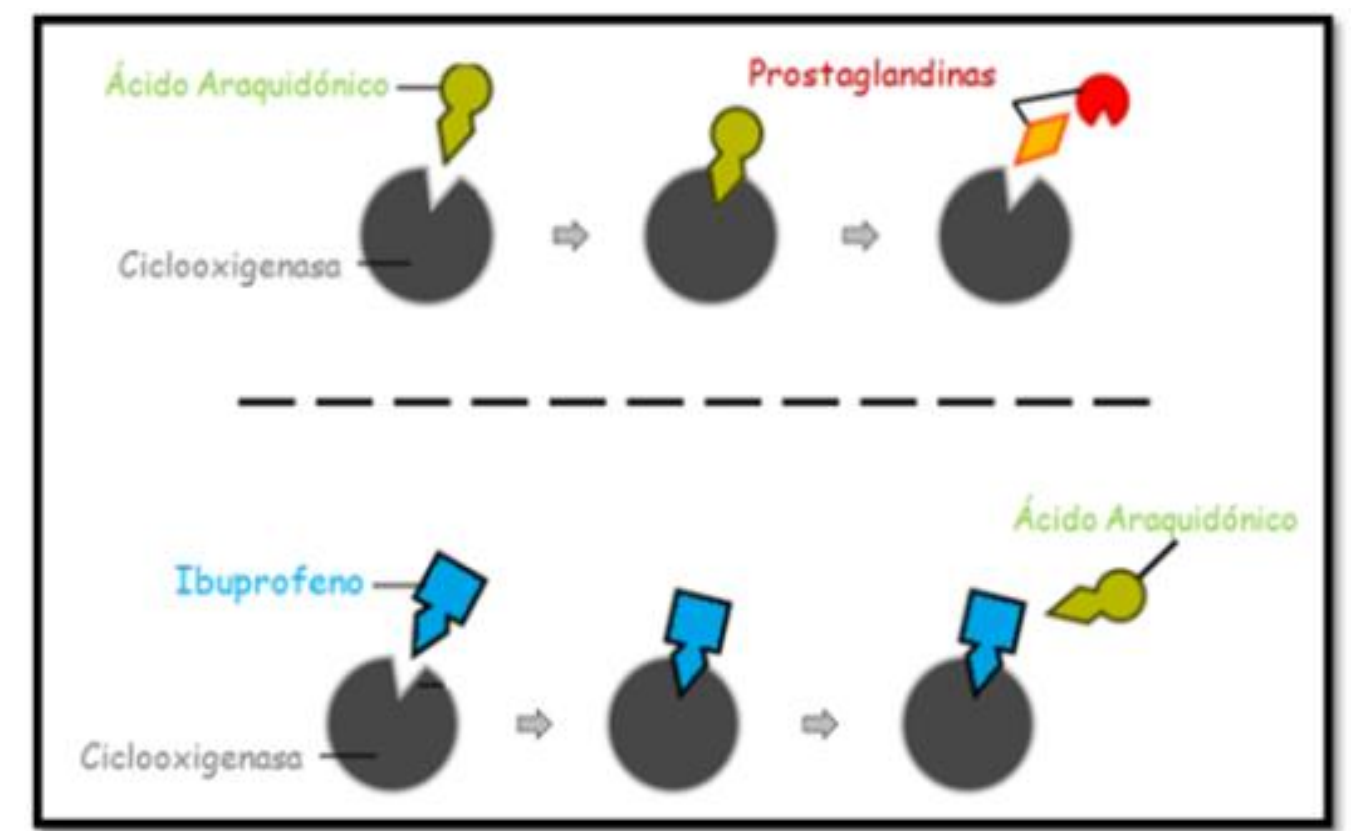


Figura 2: Mecanismo de acción del ibuprofeno

## OBJETIVOS

- Analizar las bondades que aporta cada una de las formas de dosificación que se han elaborado del activo ibuprofeno.
- Evidenciar cómo los estudios tecnológicos han aportado enormes beneficios a la terapéutica.

## METODOLOGÍA

Revisión bibliográfica a través de:

- Bases de datos: PubMed, OMS y AEMPS
- Libro: volumen III del Tratado de Tecnología Farmacéutica
- Definiciones de la Real Farmacopea Española (RFE)

## FORMAS FARMACÉUTICAS DEL IBUPROFENO

“la disposición a que se adaptan los principios activos y excipientes para constituir un medicamento”

### VÍA ORAL

VÍA PREFERENTE ✓

Gran comodidad

- X El paciente debe ser capaz de deglutir
- X Molestias digestivas
- X No efectos inmediatos

#### A) SÓLIDAS



#### 1. Liberación convencional

- Comprimidos: **Dalsy® 400 mg**
  - ✓ Exactitud de dosis
  - ✓ No sabor desagradable
  - ✓ Bajo coste
- X No ancianos y niños
- X No dosis altas de fármaco
- X Baja biodisponibilidad

- Cápsulas: **Nurofen rapid® 400 mg**

- Pueden ser duras o blandas
- ✓ Mayor BD
- ✓ Mayor estabilidad
- ✓ Más atractivas

- X Mayor coste
- X Control de HR y Tª

- Polvos: **Ibuprofeno cromadol® 200 mg**

- ✓ Dosis altas de principio activo
- ✓ Facilidad para tragar
- ✓ Mayor BD en velocidad
- ✓ No necesita agua

- X Sabor desagradable
- X Inexactitud de dosis

#### 2. Liberación modificada: El lugar y la velocidad de cesión del fármaco está regulado

- Comprimidos de liberación prolongada: **Neobrufen Retard® 800 mg**

Liberación más lenta → Reducción de la frecuencia de tomas → Aumento de la adherencia

Comprimidos bucodispersables: **Junifen® 200 mg**  
Favorecen el cumplimiento por su comodidad y rapidez de acción

Cápsula blanda masticable: **Nurofen Junior® 100 mg**

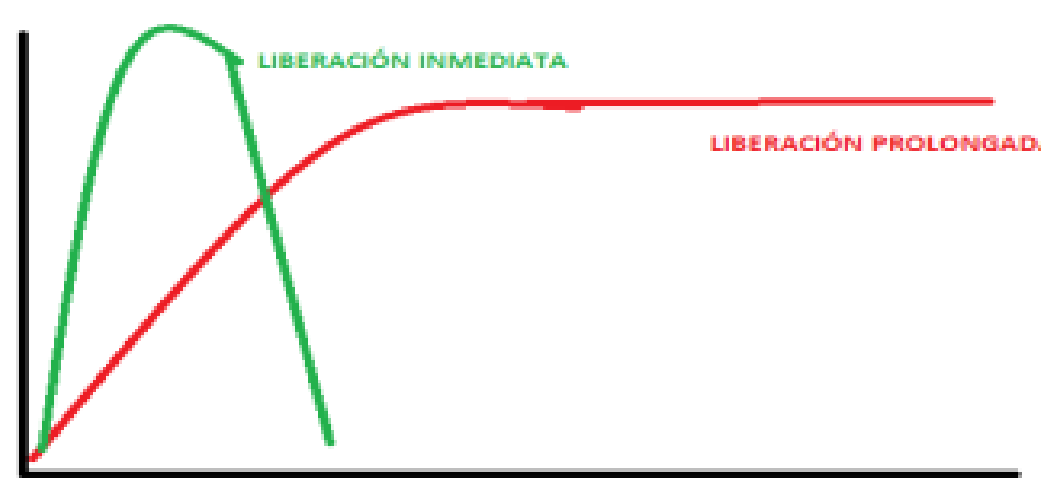


Figura 3: Liberación inmediata vs liberación prolongada

#### B) LÍQUIDAS

- ✓ Menor irritación
- ✓ Ancianos y niños
- ✓ Mayor BD
- X Inexactitud de dosis
- X Menor estabilidad
- X Difícil enmascaramiento del sabor



- Disoluciones: **Ibuprofeno (Arginina) Codeína Farmalider® 200 mg/mL +10 mg/mL**

- Suspensiones Multidosis: **Dalsy® 20 mg/ml**

- Unidosis: **Ibudol 400 mg**

- Preparaciones extemporáneas: **Neobrufen® 600 mg**

- Preparación en el momento del uso
- ✓ Mayor estabilidad
- X Necesidad de agua

- Polvos para suspensión oral
- Granulados para solución oral
- Granulados para suspensión oral
- Granulados efervescentes

### VÍA TÓPICA

Destinadas a ser aplicadas directamente sobre la piel, para ejercer una acción local o sistémica

- 1. GEL **Ibudol® 50 mg/g**: “hidrogel incoloro y transparente para el alivio local del dolor”

- o Semisólida
- o Tridimensional
- o Consistencia
- o Acción local
- ✓ Gran aceptación
- X Tendencia a la desecación
- X Bajo poder de penetración

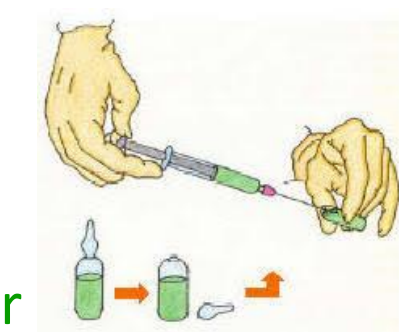
#### 2. SOLUCIÓN PARA PULVERIZACIÓN CUTÁNEA

- Diltix® 47 mg/mL**: “solución incolora con olor característico para el alivio local del dolor”

### VÍA PARENTERAL

Preparaciones estériles para inyección, perfusión o implantación

- ✓ Casos de urgencia
- ✓ Absorción total de la dosis administrada
- ✓ Pacientes que no pueden deglutir



- X Personal sanitario
- X Daño en la zona
- X Elaboración cara
- X Riesgo de cristalización

#### 1. SOLUCIÓN INYECTABLE

- Pede® 5 mg/mL**

- Solución transparente
- Vía IV durante 15 min
- Efectos inmediatos

#### 2. CONCENTRADO PARA SOLUCIÓN PARA PERFUSIÓN

- Ibuprofeno B.Braun® 600 mg**

- Dilución en el momento del uso
- Velocidad constante y lenta

### VÍA PULMONAR

Una de las más novedosas formas farmacéuticas del ibuprofeno

- ✓ Mayor BD en velocidad
- ✓ Administración de fármacos poco solubles
- ✓ Evita efectos adversos GI
- ✓ Permite administrar dosis mucho más bajas

Podría ser una alternativa a la vía intravenosa en casos de urgencia por ser menos invasiva, más fácil, cómoda y segura.

## CONCLUSIONES

### 1. Analizando la vía oral:

- Es la vía de elección
- Los comprimidos son los de primera elección por su comodidad.
- Surgieron las formas líquidas que permitieron su administración a niños y ancianos
- Las preparaciones extemporáneas aumentaron la estabilidad de las formas líquidas

### 2. Analizando la vía parenteral:

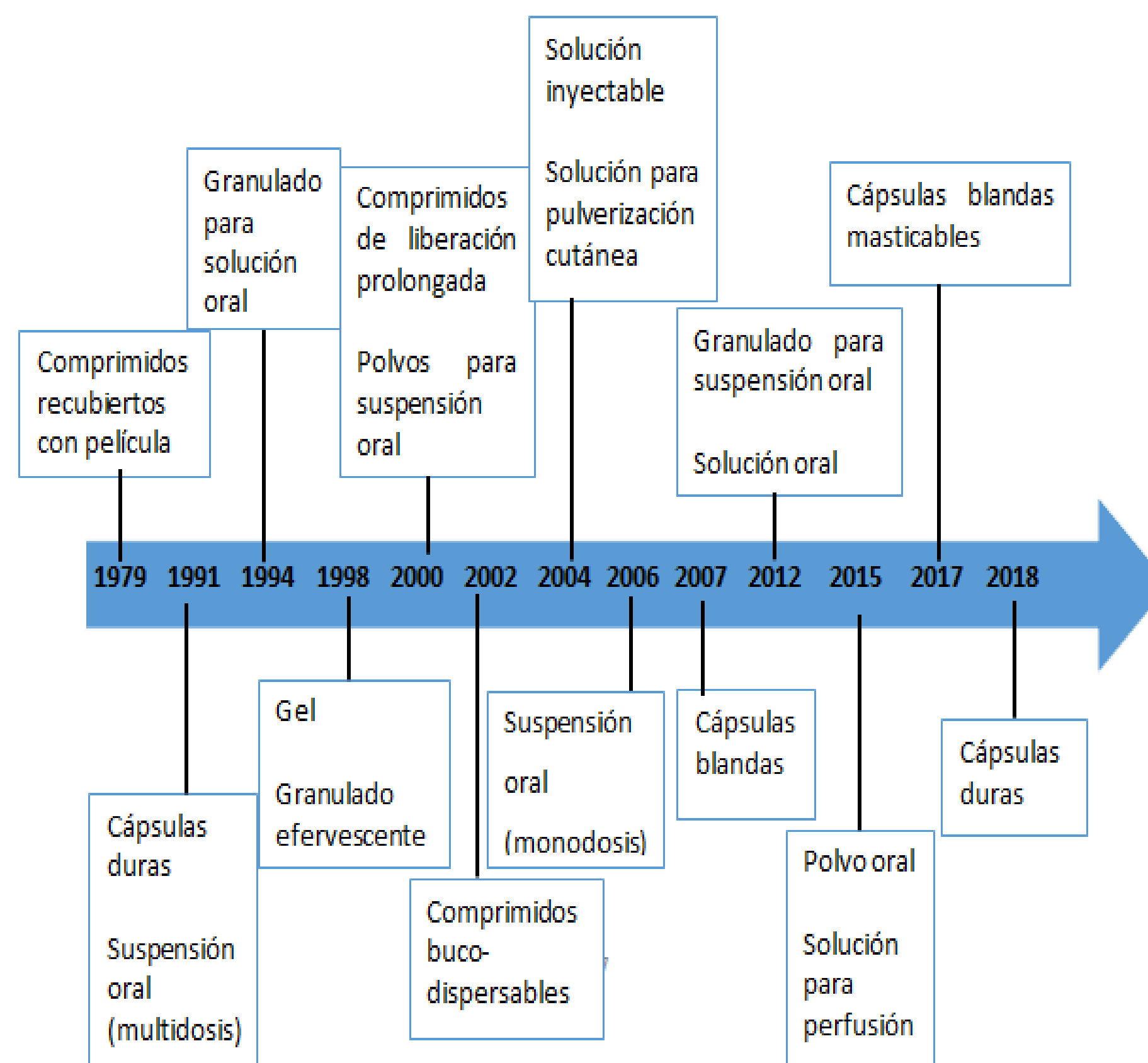
- Inicio rápido de la analgesia
- Ibuprofeno B.Braun es un concentrado para diluir en el momento del uso.

### 3. Analizando la vía tópica:

- Evitan los efectos adversos GI asociados a la vía oral
- Difícil obtener una concentración efectiva por la baja permeabilidad del ibuprofeno a través de la piel

Las innovaciones tecnológicas han permitido que el ibuprofeno se encuentre en una amplia variedad de presentaciones haciendo posible su administración a cualquier tipo de paciente.

## EJE CRONOLÓGICO DEL AÑO DE AUTORIZACIÓN DE LOS MEDICAMENTOS SELECCIONADOS



## BIBLIOGRAFÍA

- ✓ Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios-Centro de información online de Medicamentos de la Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios (AEMPS-Cima)
- ✓ OMS (2004). Formulario Modelo
- ✓ Ministerio de Sanidad, Servicios Sociales e Igualdad «BOE» núm. 177, de 25 de julio de 2015. Referencia: BOE-A-2015-8343
- ✓ Martínez Pacheco R. Tratado de Tecnología Farmacéutica. Vol.3: Formas de dosificación. Madrid: Síntesis; 2017.
- ✓ Rainsford, K.D. Fifty years since the discovery of ibuprofen. *Inflammopharmacol* 19, 293–297 (2011). <https://doi.org/10.1007/s10787-011-0103-7>
- ✓ C Rowe R, J Sheskey P, E Quinn M. Handbook Of Pharmaceutical Excipients [Internet]. 6ª ed. 2009 [citado 31 Marzo 2020]. Disponible en: [https://www.academia.edu/16731682/Handbook-of-Pharmaceutical-Excipients\\_6th\\_Edition](https://www.academia.edu/16731682/Handbook-of-Pharmaceutical-Excipients_6th_Edition)
- ✓ Jake Irvine, Afrina Afrose & Nazrul Islam (2018) Formulation and delivery strategies of ibuprofen: challenges and opportunities, *Drug Development and Industrial Pharmacy*, 44:2, 173-183, DOI: 10.1080/03639045.2017.1391838
- ✓ Preis, M., Breitkreutz, J. Pediatric Drug Development and Dosage Form Design. *AAPS PharmSciTech* 18, 239–240 (2017). <https://doi.org/10.1208/s12249-016-0705-x>