ÁCIDO URSODESOXICÓLICO

Sinónimos: Ursodiol.

Fórmula molecular: $C_{24}H_{40}O_4$

Peso molecular: 392,57

Datos Físico-Químicos: Polvo blanco o casi blanco. Muy poco soluble en agua; fácilmente soluble en alcohol; poco soluble en acetona y en cloruro de metileno. Punto de fusión: 203 ºC. Rotación óptica específica: +57º (c=2, etanol absoluto).

Propiedades y usos: El ácido ursodesoxicólico es un ácido biliar natural presente en pequeñas cantidades en la bilis humana. El ácido ursodesoxicólico suprime la síntesis y la secreción del colesterol por el hígado e inhibe la absorción intestinal del colesterol.
El ácido ursodesoxicólico se absorbe en el tubo digestivo y sufre ciclo enterohepático. Es parcialmente conjugado en el hígado antes de ser excretado por la bilis. Por influencias de las bacterias intestinales, las formas libres y conjugadas sufren una 7α-deshidroxilación pasando a ácido litocólico, parte de la cual es excretado directamente por las heces y el resto absorbido, y principalmente conjugado y sulfatado por el hígado, antes de su excreción por las heces. Sin embargo, en comparación con el acido quenodesoxicólico, el ácido ursodesoxicólico sufre menos degradación bacteriana.
Se utiliza para la disolución de cálculos biliares ricos en colesterol en pacientes con vesícula biliar funcional, y en la cirrosis biliar primaria.
El tiempo necesario para la disolución de los cálculos biliares oscila presumiblemente entre 6 y 24 meses en función del tamaño y composición del cálculo.
El ácido ursodesoxicólico es el fármaco de elección dado que es más eficaz y se asocia con menos efectos adversos que el ácido quenodesoxicólico.
El ácido ursodesoxicólico se ha ensayado en el tratamiento de la colangitis esclerosante primaria.

Dosificación: -Cálculos biliares: habitualmente 6 – 12 mg/kg/día.
-Cirrosis biliar primaria: habitualmente 10 a 15 mg/kg/día.

Efectos secundarios: El ácido ursodesoxicólico puede producir náuseas, vómitos y otras alteraciones digestivas, pero se ha descrito que la diarrea aparece con menor frecuencia que con el acido quedesoxicólico. Los incrementos de los valores enzimáticos hepáticos también son menos probables. Puede aparecer prurito. El tratamiento con acido ursodesoxicólico puede causar más calcificaciones de cálculo de colesterol que el acido quenodesoxicólico. El acido ursodesoxicólico no debe administrarse a pacientes con hepatopatía crónica, ulcera péptica o enfermedad inflamatoria intestinal. No es eficaz en la

disolución de cálculos biliares pigmentados y calcificados, y no es útil en pacientes que no tienen una vesícula biliar manifiesta y funcional. Debe evitarse durante el embarazo

Interacciones: El ácido ursodesoxicólico no debe utilizarse con fármacos como las hormonas estrogénicas, que incrementa el colesterol biliar. Debe evitarse la administración concomitante con fármacos que se unen al ácido biliar, como los antiácidos, el carbón y la colestiramina, dado que puede reducir la eficacia del tratamiento con el ácido ursodesoxicólico.

Conservación: En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.

Ejemplos de formulación:

Cápsulas coleréticas

Ácido ursodesoxicólico ……..…… 150 – 300 mg
Excipiente c.s.p……..1 cápsula

Bibliografía:

- Martindale, *Guía completa de consulta farmacoterapéutica*, 1ª ed. (2003).
- *Formulario médico farmacéutico*, PharmaBooks 2010