



Antieméticos

Frida Citlali Hernández Pérez

ENTER



01

02

03

04



¿Que son?

- Fármacos que previenen o reducen las náuseas y los vómitos.
- Los fármacos antieméticos suprimen o alivian los vómitos y la sensación de náusea y se clasifican según el receptor con el cual interactúan.



Clasificación



01

02

03

04



CLASE DE ANTIEMÉTICOS	EJEMPLOS	MÁS EFECTIVO CONTRA
Antagonistas ^a de los receptores 5TH ₃	Ondansetrón	Emesis inducida por fármacos citotóxicos
Antagonistas del receptor de la dopamina de acción central	Metoclopramida ^b Prometazina ^c	
Agonistas del receptor cannabinoide	Dronabinol Nabilona	
Antagonistas receptores de la neurocinina	Aprepitant	Emesis inducida por fármacos citotóxicos (vómitos retardados)
Antagonistas de la histamina H ₁	Ciclizina	Emesis vestibular (cinetosis)
Antagonista del receptor muscarínico	Hioscina (escopolamina)	

Los antieméticos generalmente se clasifican en correspondencia con el receptor predominante en el que se proponen actuar



Antagonistas del receptor 5HT3



01

02

03

04



Mecanismo de acción

Los receptores 5HT3 están presentes en varios sitios críticos implicados con la emesis, incluidos los aferentes vagales, el STN (que recibe señales de los aferentes vagales) y el área postrema.

```
graph LR; A((La serotonina es liberada por las células enterocromafines)) --> B((Inicia el reflejo del vómito)); B --> C((Las concentraciones más altas de receptores 5HT3 en el CNS se encuentran en el STN y la CTZ.));
```

La serotonina es liberada por las células enterocromafines

Inicia el reflejo del vómito

Las concentraciones más altas de receptores 5HT3 en el CNS se encuentran en el STN y la CTZ.



Indicaciones



01

02

03

04



- Náuseas inducidas por la quimioterapia
- Tratamiento de náuseas secundarias a la irradiación abdominal superior.
- Hiperémesis del embarazo
- En menor grado, las náuseas posoperatorias



Efectos adversos



01

02

03

04



- Estreñimiento o diarrea
- Dolor de cabeza
- Aturdimiento
- síndrome de la serotonina


Dosis

TABLA 50-6 ■ Antagonistas 5HT₃ en náuseas/emesis inducidas por quimioterapia

FÁRMACO	NATURALEZA QUÍMICA	INTERACCIONES DEL RECEPTOR	t _{1/2}	DOSIS PARA ADULTOS (IV)
Ondansetrón	Derivado del carbazol	Antagonista 5HT ₃ , antagonista débil 5HT ₄	3.9 h	0.15 mg/kg
Granisetrón	Indazol	Antagonista 5HT ₃	9-11.6 h	10 µg/kg
Dolasetrón (no aprobado en Estados Unidos)	Mitad de indol	Antagonista 5HT ₃	7-9 h	1.8 mg/kg
Palonosetrón	Isoquinolina	Antagonista 5HT ₃ ; la mayor afinidad para el receptor 5HT ₃ en clase	40 h	0.25 mg



Antagonistas del receptor de dopamina



Mecanismo de acción

El principal mecanismo de acción de los antagonistas de los receptores de la dopamina es el antagonismo del receptor D2 en la CTZ, que reduce la liberación de neurotransmisores excitadores



Fenotiazinas



01



02

Indicaciones

03

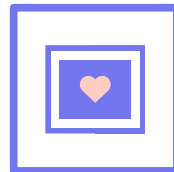
Poseen actividades antihistamínicas y anticolinérgicas valiosas para otras formas de náuseas y vómitos, como la cinetosis y aquellos de origen GI

04



Dosificación

5-10 mg por vía oral cada 6-8 h, 5-10 mg de forma intramuscular, o de 2.5 mg a 10 mg por vía intravenosa cada 3-4 h, o 25 mg por vía rectal cada 12 h.



Efectos adversos

Reacciones extrapiramidales, que incluyen:

- Distonía
- Efectos cardiacos
- Hipotensión.



Benzamidas



01

02

03

04



- Tratamiento de los trastornos motores GI.
- La metoclopramida es un tratamiento útil de la emesis retardada.
- La trimetobenzamida se administra para la gastroenteritis y las náuseas y los vómitos posoperatorios.

Olanzapina.



- Prevención de las náuseas y vómitos retardados asociados a la quimioterapia.
- Tratamiento de las náuseas y los vómitos refractarios no inducidos por la quimioterapia.
- Las reacciones adversas son extensas e incluyen muchos efectos secundarios del CNS, cardiovasculares y metabólicos



01

02

03

04



Antihistamínicos



- Principalmente útiles para la cinetosis y la emesis posoperatoria.
- La sedación es siempre un efecto secundario común de estos medicamentos.
- Actúan sobre los aferentes vestibulares y dentro del tronco encefálico.

Agentes anticolinérgicos



- Prevención y tratamiento de la cinetosis, con cierta actividad en las náuseas y los vómitos posoperatorios.
- Los principales efectos secundarios son sequedad de la boca, alteraciones visuales y somnolencia.



01

02

03

04



Antagonistas del receptor de la neurokinina

Mecanismo de acción



Los antagonistas de los receptores NK1, los receptores para el neuropéptido sustancia P como el aprepitant, tiene efectos antieméticos en las náuseas retardadas.



01

02

03

04



Aprepitant.



Usos terapéuticos y efectos adversos.

- Contraindicado en pacientes que toman la cisaprida o la pimozida.
- se suministra en cápsulas de 40, 80 y 125 mg y se administra durante 3 días

Rolapitant.



Usos terapéuticos y efectos adversos.

- Dosis simple de 180 mg por vía oral 1-2 h antes de la quimioterapia.
- Los efectos adversos incluyen neutropenia, hipo, disminución del apetito y mareos.



01

02

03

04



Cannabinoïdes

A large light orange rectangular area with a blue border, serving as the main content area. It contains the title 'Cannabinoïdes' in the center. A smaller white rectangular window with a blue border and a blue 'X' icon in the top right corner is overlaid on the bottom right of this area.



01

Mecanismo de acción

Estimulación del subtipo CB1 de receptores cannabinoides en las neuronas y alrededor del centro CTZ y emético

02

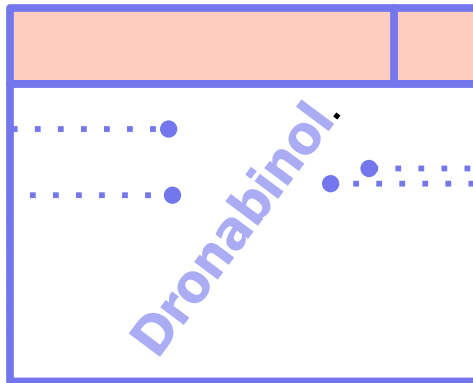
03

04



Indicaciones

- Agente profiláctico útil en pacientes que reciben quimioterapia.
- Estimular el apetito. Pacientes con sida y anorexia.



Dosis

Inicial de 5 mg/m² en 1-3 h antes de la quimioterapia y luego cada 2-4 h después para un total de cuatro a seis dosis.

Efectos adversos

- Actividad simpaticomimética central prominente.
- "Excitación" similar a la de la marihuana
- Síndrome de abstinencia



Preguntas



01

¿Cuál es el mecanismo de acción de los antagonistas del receptor de dopamina?
Antagonismo del receptor D2 en la CTZ.

02

03

¿Cuáles son los efectos adversos del Rolapitant?
Neutropenia, hipo, disminución del apetito y mareos.

04

