



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.

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

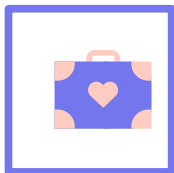


Mecanismo de acción

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



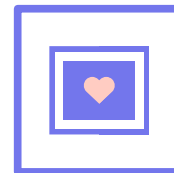
Indicaciones

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



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.



01

02

03

04





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.

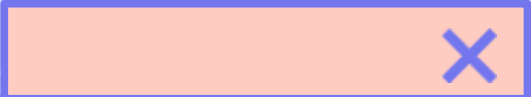


01

02

03

04



Cannabinoïdes





01

Mecanismo de acción

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

02

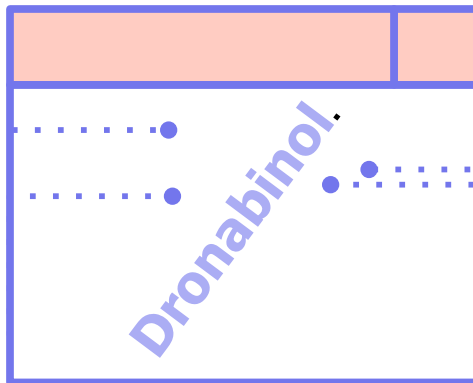
03

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

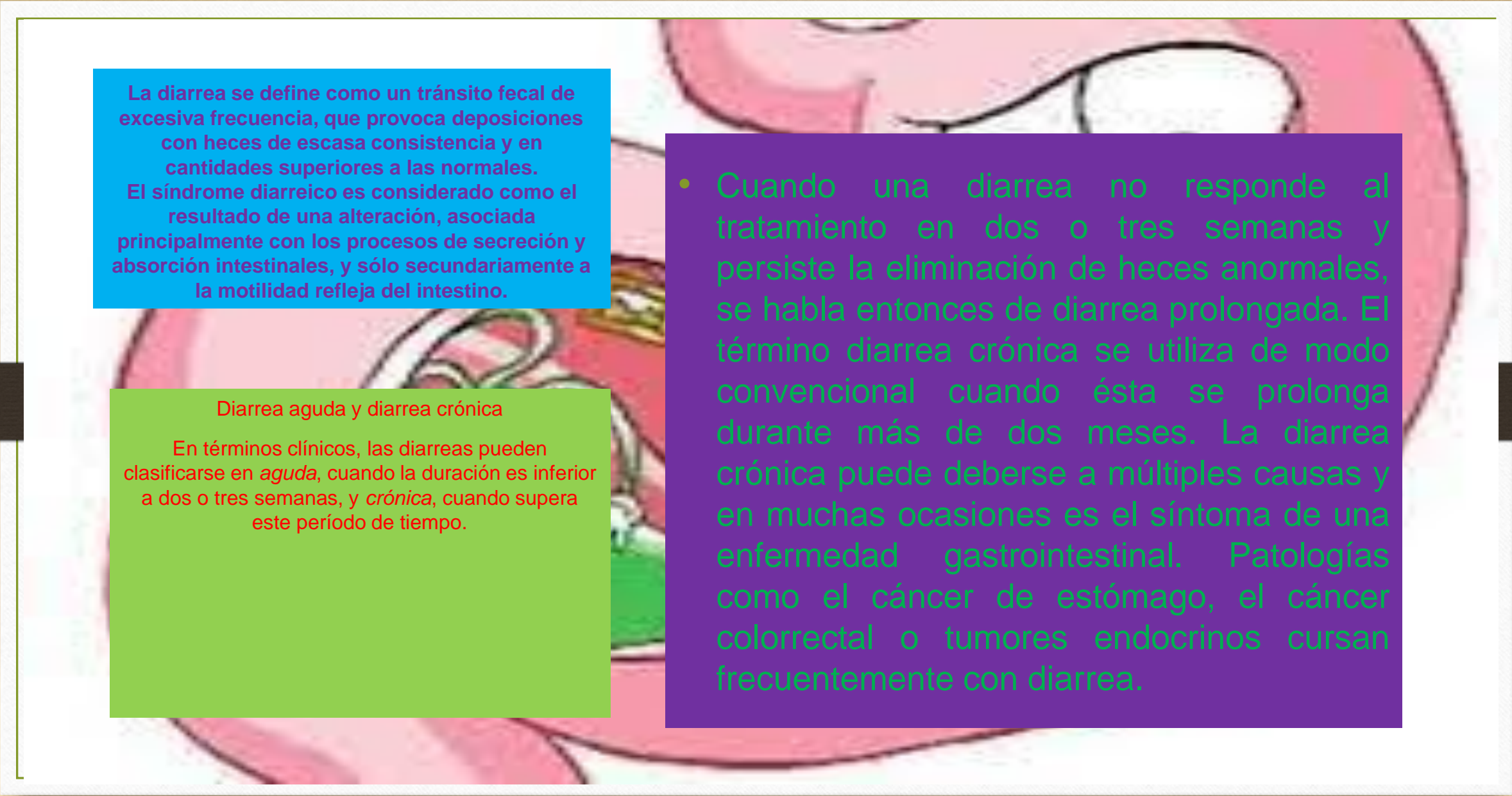
¿Cuáles son los efectos adversos del Rolapitant?
Neutropenia, hipo, disminución del apetito y mareos.

04



ANTIDIARRÉICOS





La diarrea se define como un tránsito fecal de excesiva frecuencia, que provoca deposiciones con heces de escasa consistencia y en cantidades superiores a las normales.

El síndrome diarreico es considerado como el resultado de una alteración, asociada principalmente con los procesos de secreción y absorción intestinales, y sólo secundariamente a la motilidad refleja del intestino.

Diarrea aguda y diarrea crónica

En términos clínicos, las diarreas pueden clasificarse en *aguda*, cuando la duración es inferior a dos o tres semanas, y *crónica*, cuando supera este período de tiempo.

- Cuando una diarrea no responde al tratamiento en dos o tres semanas y persiste la eliminación de heces anormales, se habla entonces de diarrea prolongada. El término diarrea crónica se utiliza de modo convencional cuando ésta se prolonga durante más de dos meses. La diarrea crónica puede deberse a múltiples causas y en muchas ocasiones es el síntoma de una enfermedad gastrointestinal. Patologías como el cáncer de estómago, el cáncer colorrectal o tumores endocrinos cursan frecuentemente con diarrea.

Rehidratación oral

La *solución de rehidratación oral* permite absorber agua y sodio en el intestino inflamado, acoplados a la fuerza de absorción de la glucosa. La fórmula recomendada por la OMS contiene cloruro sódico (3,5), cloruro potásico (1,5), glucosa (20) y citrato trisódico (2,9) o bicarbonato sódico (2,5).

Agentes probióticos

Los agentes *probióticos* (*Lactobacillus reuteri*, *Lactobacillus GG*, *Bifidobacterium*, se están utilizando últimamente con gran profusión en la prevención y tratamiento de la diarrea viral aguda (por rotavirus), en el tratamiento de la diarrea recurrente causada por *Clostridium difficile*, así como para el control de la diarrea asociada a la administración de antibióticos.

• Dieta

- Junto a la rehidratación oral, se ha de establecer una *pauta dietética* adecuada. En niños mayores de 10 años y adultos puede recomendarse el ayuno total durante un máximo de 24 horas, sin olvidar la ingesta de líquido. Al cabo de este tiempo, se iniciará la ingesta de una dieta blanda hasta normalizar paulatinamente el plan de comidas.

Farmacoterapia

El abordaje terapéutico de la diarrea puede requerir, además, *medidas farmacológicas*. El tratamiento farmacológico de la diarrea dependerá de su intensidad, duración y causa. Los fármacos antidiarreicos están dirigidos a reducir o suprimir los síntomas propios de la diarrea, bien mediante un efecto específico, atacando a la causa etiológica del proceso, o bien mediante un efecto inespecífico, paliativo de la sintomatología.

- Los fármacos inespecíficos no sólo modifican la textura de las heces, sino que, sobre todo, incrementan la eficacia de absorción intestinal. Para ello, aumentan la velocidad de absorción de agua y electrolitos en los enterocitos y deprimen el tránsito intestinal. Como consecuencia, la absorción de fluidos también se incrementa..

Clasificación de los fármacos antidiarreicos

Fármacos de acción intraluminal

Son fármacos que ejercen su acción de modo localizado sobre lo intestinal. Son fármacos muy experimentados y seguros, al ser productos biológicamente inertes.

Inhibidores de la motilidad gastrointestinal

Estos agentes no se deben utilizar en las diarreas autolimitadas agudas, sobre todo en niños pequeños, ya que pueden producir una falsa sensación de seguridad, cuando en realidad están impidiendo la limpieza de la flora patógena

En los casos de diarrea aguda de origen infeccioso, el tratamiento debe ir dirigido preferentemente a reponer las pérdidas hidroelectrolíticas. Los principios activos antidiarreicos más usados son:

FARMACOS ANTIDIARREICOS

Loperamida
Kaopectate
Treda

Loperamida. Se administra en forma de clorhidrato que se absorbe por vía oral. Atraviesa con dificultad la barrera hematoencefálica, por lo que es capaz de actuar intensamente a nivel gastrointestinal, sin producir efectos en el SNC

Difenoxilato. : Que se absorbe fácilmente tras su administración oral difenoxina, metabolito activo con una vida media de unas 12 horas. A dosis bajas (2,5-5 mg) sólo presenta acción periférica antidiarreica, mientras que a dosis altas (40-60 mg) produce efectos centrales (euforia, dependencia física, etc.).

LOS PILARES BASICOS DEL TRATAMIENTO DE LA DIARREA AGUDA LEVE O MODERADA SON

- 1.-Uso de la rehidratación oral
- 2.-Pronta reparación intestinal con una alimentación adecuada
- 3.-Tratamiento etiológico si se conoce la causa
- 4.-En l diarrea del lactante continuar con la lactancia natural en todo los casos.



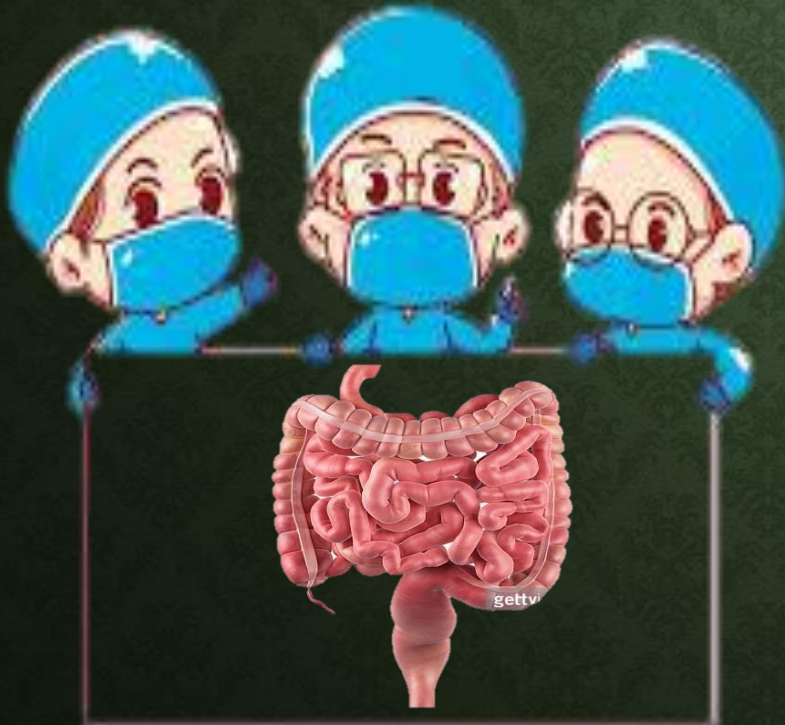
¿EN QUE CONSISTE LA DIARREA?

La diarrea se define como un tránsito fecal de excesiva frecuencia, que provoca deposiciones con heces de escasa consistencia y en cantidades superiores a las normales.

¿MENCIONA 3 MEDICAMENTOS ANTIDIARREICOS?

Loperamida
Kaopectate
Treda

“REGULADORES DE LA MOTILIDAD INTESTINAL”



Mussolini Macnealy Paz



Segmentación

❖ Hay diversos factores que pueden alterar la motilidad intestinal, inhibiéndola, estimulándola o modificando el tiempo de tránsito por el intestino.

❖ Estas alteraciones contribuyen a la aparición de disfunciones intestinales, cuyas manifestaciones más frecuentes son la diarrea y el estreñimiento.

Peristaltismo

❖ A la gran cantidad de factores fisiológicos o patológicos que pueden afectar a la motilidad intestinal, deben añadirse factores ambientales, que dependen del entorno de cada individuo. Entre ellos, por su importancia, cabe destacar la dieta y el sedentarismo.



¿QUE SON LOS REGULADORES DE LA MOTILIDAD INTESTINAL?

❖ Son todos aquellos fármacos que van a regular o normalizar los movimientos de motilidad (peristáltica y segmentación).

1.- Antidiarreicos.

2.- Laxantes.



“LAXANTES”



Por diferentes factores:


¿Estreñimiento?




Como valorarlo:




Es clínico y se valora cuando el paciente tiene de 3 a 4 defecaciones / semana.

- 
- 1.- dieta por poca fibra.
 - 2.- sedentarismo.
 - 3.- una hidratación no adecuada.
 - 4.- fármacos.

Tratamiento:

- 
- 1.-solucionar la causa.
 - 2.- sintomático.
 - 3.-recomendaciones dietéticas.
 - 4.- ejercicio.



❖ Alteración del intestino que consiste en una excesiva retención de agua en el intestino grueso y el consiguiente endurecimiento de las heces, por lo cual se hace muy difícil su expulsión.

“FORMADORES DE MASA”

- ❖ Sustancias que incrementan el volumen del contenido intestinal.
 - ❖ Estimulan la actividad motora.
- ❖ Muchas actúan absorbiendo agua e hinchándose para aumentar la masa.

Sustancias que integra:

- ❖ Productos ricos en celulosa.
- ❖ Metilcelulosa.
- ❖ Preparados de psyllium.

- 1.- administración V.O.
- 2.- no actúa de forma inmediata (esperar varios días).
- 3.- útil en estreñimiento simples o pacientes que quieren evitar esfuerzos

- 1.- efectos adversos: pueden producir obstrucción intestinal y flatulencia.

“SUAVIZANTES O LUBRIFICANTES”

❖ Son agentes vegetales que lubrican y ablandan la masa fecal, mejorando su cambio de consistencia.

Ingredientes:

1.- glicerol.

2.- docusato sódico.

3.- aceite de parafina.

❖ Por vi rectal en caso de que no pueda usarse los fármacos formadores de masa o en pacientes con fisura anal o hemorroides.

“LAXANTES OSMÓTICOS”

- ❖ **Compuestos que apenas se absorben en el intestino y actúan de forma osmotica.**
- ❖ **Esto atraerá agua hacia el interior del intestino aumentando la estimulación y la eliminación de las heces.**

Integrantes:

1.- sales de magnesio.

2.- sales de sodio.

- ❖ **Por V.O. actúan de forma rápida e intensa en el intestino delgado, por lo que suelen utilizarse por Vía rectal.**
- ❖ **Por vía oral se utilizaran previamente ala realización de pruebas diagnosticas.**

“DERIVADOS DE AZUCARES”

❖ No se absorben en el intestino delgado y llegan al colon donde son metabolizados dando lugar a metabolismo que reducen el PH y tienen efectos osmóticos.

Contenido:

1.- lactulosa.

2.- lactitol.

3.- sorbitol.

1.- Tardan varios días en actuar.

2.- Pueden producir flatulencia, dolor crónico, molestias abdominales, nauseas, vómitos, diarreas.

“ANTIDIARRÉICOS”

❖ ¿Diarrea?

❖ Alteración intestinal que se caracteriza por la mayor frecuencia, fluidez y, a menudo, volumen de las deposiciones.

agudas

Crónicas

Infecciones
virales o
bacterianas

Enfermedades
crónicas



Tratamiento:

1.- solo se trata farmacológicamente cuando haya riesgo de deshidratación o desequilibrio hidroeléctrico.

“INHIBIDORES DE LA MOTILIDAD”

❖ **Fundamentalmente fármacos opioides:**

Como:

1.- Loperamida.

2.- codeína.

❖ **Abajas dosis se absorben poco.**

❖ **Escasos efectos sobre el SNC pero
arcados sobre el aparato
digestivo.**

❖ **Se utiliza fundamental mente en
el tratamiento sintomático de la
diarrea aguda.**

“INHIBIDORES DE LA HIPERSECRECIÓN INTESTINAL”

❖ Son fármacos como lo son:

1.- rofecadotriilo.

2.- octreotida.

3.- subsalicílico de bismuto.

4.- berberina



❖ Se utilizan en el tratamiento de la diarrea aguda.

“MODIFICADORES DEL TRASPORTE DE ELECTROLITOS”

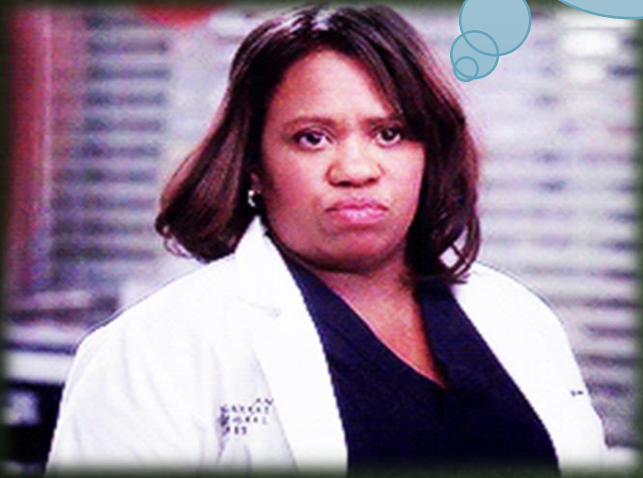
❖ Son fármacos como lo son:

❖ Aminosalicilatos.

❖ Glucocorticoides.

❖ Utilizado en la enfermedad inflamatoria intestinal.

¿Dudas?



1.- ¿como actúan los laxantes osmóticos?

2.- ¿a que grupo de antidiarreico pertenecen Loperamida, codeína?

“GRACIAS POR SU ATENCIÓN DOCTORES”