



Medicina Humana

Nombre del alumno: Luz Angeles Jiménez
Chamec

Nombre del profesor: Dr. Natanael Ezri Prado
Hernández

Nombre del trabajo: Mapas conceptuales

PASIÓN POR EDUCAR

Materia: Farmacología

Grado y grupo: 3° B

Antagonistas de los adrenoreceptores alfa

Prazosina

Se usa para tratar la hipertensión

La dosis inicial debe ser de 1mg.

Por lo regular se administra antes de acostarse, para reducir el riesgo de algunas reacciones.

La dosis se ajusta según la presión arterial.

Terazosina

Tiene una vida de 12 horas.

Puede administrarse una vez al día.

Con dosis de 5-20 mg/d.

La prazosina, la terazosina y la doxazosina producen la mayoría de sus efectos antihipertensivos bloqueando los receptores α_1 en las arteriolas y las vénulas.

Los bloqueadores α reducen la presión arterial al dilatar los vasos de resistencia y de capacitancia.

Doxazina

Tiene una vida media de 22 horas

Se administra una vez al día, comenzando con mg/d

Y progresando a 4mg/d o más, según sea necesario

Efectos adversos

- Mareos.
- Palpitaciones.
- Dolor de cabeza.
- Lasitud.
- Debilidad.
- Nauseas.
- Cansancio.

Simpaticolíticos de acción central (metildopa)

ADME

Usos terapéuticos

Es un profármaco que se metaboliza en el cerebro a la forma activa, su Cp tiene menos relevancia para sus efectos que para muchos otros medicamentos.

Se excreta en la orina principalmente como el conjugado de sulfato (50-70%) y como fármaco original (25%).

La t_{1/2} de metildopa se prolonga a 4-6 h en pacientes con insuficiencia renal.

Un agente antihipertensivo de acción central, es un profármaco que ejerce su acción antihipertensiva a través de un metabolito activo.

es metabolizado por la descarboxilasa de aminoácidos l-aromáticos en neuronas adrenérgicas a la α -metildopamina, que luego se convierte en α -metilnorepinefrina, el metabolito farmacológicamente activo.

Es un fármaco preferido para el tratamiento de la hipertensión durante el embarazo en función de su efectividad y seguridad tanto para la madre como para el feto.

La dosis inicial habitual de metildopa es de 250 mg dos veces al día; hay poco efecto adicional con dosis mayores a 2 g/d.

Efectos adversos

Produce sedación que es en gran medida transitoria.

Puede producir sequedad en la boca

Incluyen disminución de la libido, signos parkinsonianos e hiperprolactinemia que pueden ser lo suficientemente pronunciados como para causar ginecomastia y galactorrea.

Beta bloqueadores

Absorción

Los fármacos se absorben en la administración oral

Las concentraciones pico ocurren de una a tres horas después de la ingestión.

Se dispone de preparaciones de liberación sostenida del propranolol y metoprolol.

Distribución

Se distribuyen con rapidez y tienen grandes volúmenes de distribución

El propranolol y el penbutolol son bastante lipofílicos y cruzan con facilidad la barrera hematoencefálica

El propranolol y el metoprolol se metabolizan con amplitud en el hígado, con poca presencia de fármaco inalterado en la orina.

Efectos SCV

Son administrados crónicamente disminuyen la presión arterial en pacientes con hipertensión

Ocupan los receptores β y reducen competitivamente la ocupación de los receptores por catecolaminas y otros agonistas β .

Los agonistas parciales inhiben la activación de los receptores β en presencia de altas concentraciones de catecolamina, pero activan a los receptores de forma moderada en ausencia de agonistas endógenos.

Enfermedades

- Hipertensión
- Enfermedad isquémica del corazón
- Arritmia cardíaca
- Insuficiencia cardíaca
- Hipertiroidismo
- Enfermedades neurológicas

Efetos adversos

- La bradicardia es el efecto cardíaco adverso más común de los fármacos bloqueadores beta
- Los efectos del SNC incluyen sedación leve, sueños vívidos y depresión
- Empeoramiento del asma preexistente y otras formas de obstrucción de la vía aérea

Biodisponibilidad

El propranolol sufre un amplio metabolismo hepático

Su biodisponibilidad es relativamente baja

La circulación sistémica aumenta a medida que se incrementa la dosis, lo que sugiere que los mecanismos de extracción hepática pueden saturarse.

Semi vida

Tres a 10 horas

El esmolol, que se hidroliza muy rápido y tiene una semivida de alrededor de 10 min.

El nadolol se excreta inalterado en la orina y tiene la semivida hasta 24 horas, la semivida del nadolol se prolonga en la insuficiencia renal.

Efectos TR

El bloqueo de los receptores β_2 en el músculo liso bronquial puede conducir a un aumento en la resistencia de las vías respiratorias, particularmente en pacientes con asma

Vasodilatadores

Hidralazina

Relaja directamente el músculo liso arteriolar con poco efecto sobre el músculo liso venoso.

Se absorbe bien a través del tracto gastrointestinal.

Puede ser útil en el tratamiento de algunos pacientes con hipertensión grave

La dosis oral habitual de hidralazina es de 25-100 mg dos veces al día.

Incluyen dolor de cabeza, náuseas, rubor, hipotensión, palpitaciones, taquicardia, diarrea y angina de pecho

Hidralazina

El nitroprusiato es un nitrovasodilatador que actúa liberando NO.

El medicamento debe estar protegido de la luz y administrarse por infusión intravenosa continua para que sea efectivo.

La mayoría de los pacientes hipertensos responden a una infusión de 0.25-1.5 $\mu\text{g}/\text{kg}/\text{min}$.

Los signos y síntomas de toxicidad por tiocianato incluyen anorexia, náuseas, fatiga, desorientación y psicosis tóxica.

Activadores de canales KATP: minoxidil

El minoxidil no está activo in vitro sino que debe ser metabolizado por la sulfotransferasa hepática a molécula activa, sulfato de N-O del minoxidil

Se absorbe bien a través del tracto gastrointestinal.

La mayor parte del fármaco absorbido se elimina como un glucurónido; alrededor del 20% se excreta sin cambios en la orina.

El minoxidil tiene una $t_{1/2}$ en plasma de 3-4 h, pero su duración de acción es de 24 h y ocasionalmente incluso más

La dosis diaria inicial de minoxidil puede ser tan pequeña como 1.25 mg, que puede aumentar gradualmente a 40 mg en una o dos dosis diarias.

Antagonistas del CA no dihidropiridínicos

Los bloqueadores de los canales de calcio también reducen la resistencia periférica y la presión sanguínea.

En la hipertensión es la inhibición de la entrada de calcio en las células del músculo liso arterial

Fármacos

- Verapamilo
- Diltiazemla
- La familia de la dihidropiridin

Activación

Simpática refleja con taquicardia leve mantiene o aumenta el gasto cardiaco en la mayoría de los pacientes que reciben dihidropiridinas. El verapamilo tiene el mayor efecto depresivo sobre el corazón y puede disminuir la frecuencia cardiaca y el gasto cardiaco el diltiazem tiene acciones intermedias.

Diferencias

Hemodinámicas entre los bloqueadores de los canales de calcio pueden influir en la elección de un agente particular. El nifedipino y los otros agentes dihidropiridínicos son más selectivos como vasodilatadores y tienen menos efecto depresor cardiaco que verapamilo y el diltiazem.

Antagonistas del CA dihidropiridínicos

Bloqueo no selectivo de canales de calcio de tipo L en vasos y corazón Bloqueo de canales de calcio de tipo L vascular > canales cardiacos

Fármacos

- Verapamilo
- Diltiazem
- Nifedipina
- Amlodipina
- Felodipina

Efectos

Reducción de la resistencia vascular, la frecuencia cardiaca y la fuerza cardiaca dan como resultado una disminución de la demanda de oxígeno

Usos terapéuticos

La profilaxis de la angina y el tratamiento de la hipertensión

Referencias bibliográficas:

- GOODMAN & GILMAN LAS BASES DE FARMACOLOGÍA TERAPÉUTICA 13a EDICIÓN. LAURENCE L. BRUNTON, RANDA HILAL-DANDAN, BJORN, C. KNOLLMANN. PAG 514.
- FARMACOLOGÍA BÁSICA Y CLÍNICA KATZUNG 14° EDICIÓN. BERTRAM G. KATZUNG