



## MEDICINA HUMANA

**Nombre del alumno: Jhonatan Sanchez Chanona**

**Docente: Natanael Ezri Prado Hernández**

**Nombre del trabajo: “mapas conceptuales”**

**Materia: Farmacología**

**Grado: 3°**

**Grupo: “B”**

PASIÓN POR EDUCAR

Comitán de Domínguez Chiapas a 12 de noviembre de 2021.

***Antihipertensivos***

# Antagonistas de los adrenorreceptores alfa

## Prazosina

Se usa para tratar la hipertensión

### Mecanismo y sitio de acción

Producen la mayoría de sus efectos antihipertensivos bloqueando los receptores  $\alpha_1$  en las arteriolas y las vénulas.

Los bloqueadores  $\alpha_1$  reducen la presión arterial al dilatar los vasos de resistencia y de capacitancia.

### Fármacos

- Prazosina
- Terazosina
- Doxazosina

### Farmacocinética

#### Efectos

- Evita la vasoconstricción simpática.
- Reduce el tono del músculo liso prostático.

#### Vía de administración

Oral

#### Uso terapéutico

- Hipertensión.
- Hiperplasia prostática benigna.

### Dosis y administración

#### Prazosina

- Administración vira oral.
- 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.
- En el tratamiento de la BPH (Hiperplasia Benigna de Próstata), es recomendable usar dosis típicas de 1 a 5 mg dos veces al día.

#### Terazosina

- Tiene una vida de 12 horas.
- Puede administrarse una vez al día.
- Con dosis de 5-20 mg/d.

#### Doxazosina

- Tiene una vida media de 22 horas.
- Por lo general, se administra una vez al día, comenzando con 1 mg/d y progresando a 4 mg/d o más, según sea

### Efectos adversos

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

Las toxicidades informadas algunas son relativamente raras y leves.

# Simpaticolíticos de acción Central

## Metildopa

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

### Mecanismo de acción

Ejerce su acción antihipertensiva a través de un metabolito activo.

Metildopa ( $\alpha$ -metil-3,4-dihidroxi-l-fenilalanina), un análogo de DOPA, es metabolizado por la descarboxilasa de aminoácidos l-aromáticos en neuronas adrenérgicas a la  $\alpha$ -metildopamina, que luego se convierte en  $\alpha$ -metilnorepinefrina, el metabolito farmacológicamente activo.

### Farmacocinética

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

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

### Uso terapéutico

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.

### Dosis

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.

La administración de una sola dosis diaria de metildopa a la hora de acostarse minimiza los efectos sedantes, pero se requiere la administración dos veces al día para algunos pacientes.

### Efectos adversos

Produce sedación que es en gran medida transitoria.

Una disminución en la energía psíquica puede persistir en algunos pacientes, y la depresión ocurre ocasionalmente.

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.

# Betabloqueadores

Los fármacos betabloqueadores ocupan los receptores  $\beta$  y reducen competitivamente la ocupación de los receptores por catecolaminas y otros agonistas  $\beta$ .

## Mecanismo de acción

inhiben la activación de los receptores  $\beta$  en presencia de altas concentraciones de catecolamina, pero activan a los receptores de forma moderada en ausencia de agonistas endógenos

## farmacocinética

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.

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.

## Farmacocinética

los efectos de estos fármacos se deben a la ocupación y al bloqueo de los receptores  $\beta$  incluyendo la actividad agonista parcial en los receptores  $\beta$  y la acción anestésica local, que difieren entre los bloqueadores  $\beta$

Efectos en el sistema cardiovascular  
son administrados crónicamente disminuyen la presión arterial en pacientes con hipertensión  
Efectos en el tracto respiratorio  
El bloqueo de los receptores  $\beta_2$  en el músculo liso bronquial puede conducir a un aumento en la resistencia de las vías respiratorias, particularmente en pacientes con asma

## Semivida

Tres a 10 horas.  
El esmolol se hidroliza muy rápido y tiene una semivida de alrededor de 10 minutos  
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.

## Uso terapéutico

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

## Efectos 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

# Vasodilatadores

## Hidralazina

Fue uno de los primeros fármacos antihipertensivos activos por vía oral que se comercializaron en Estados Unidos

El medicamento inicialmente se usó con poca frecuencia debido a taquicardia y taquifilaxia

### Mecanismo de acción

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

Pueden implicar una reducción en las concentraciones de  $Ca^{2+}$  intracelular.

Liberación de óxido nítrico del fármaco o del endotelio.

### Farmacocinética

- La hidralazina se absorbe bien a través del tracto gastrointestinal.
- La hidralazina es N-acetilada en el intestino y el hígado, lo que contribuye a la baja biodisponibilidad del fármaco (16% en acetiladores rápidos y 35% en acetiladores lentos).
- La hidralazina se combina rápidamente con los  $\alpha$ -cetoácidos circulantes para formar hidrazonas, y el principal metabolito recuperado del plasma es hidralazina ácido pirúvico hidrazona.
- Aunque la tasa de acetilación es un determinante importante de la biodisponibilidad de la hidralazina, no juega un papel en la eliminación sistémica del fármaco, probablemente porque la depuración hepática es tan alta que la eliminación sistémica es principalmente una función del flujo sanguíneo hepático

### Usos terapéuticos

- puede ser útil en el tratamiento de algunos pacientes con hipertensión grave, puede ser parte de la terapia basada en la evidencia en pacientes con insuficiencia cardiaca congestiva
- puede ser útil en el tratamiento de emergencias hipertensivas, especialmente preeclampsia, en mujeres embarazadas

Debe usarse con gran precaución en pacientes de edad avanzada y en pacientes hipertensos con CAD debido a la posibilidad de precipitar isquemia miocárdica debido a taquicardia refleja.

### Dosis

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

La dosis máxima recomendada de hidralazina es de 200 mg/día para minimizar el riesgo de síndrome de lupus inducido

La administración dos veces al día es tan efectiva como la administración cuatro veces al día para el control de la presión arterial, independientemente del fenotipo de acetilador.

### Efectos adversos

La disminución de la presión sanguínea después de la administración de la hidralazina se asocia con una disminución selectiva de la resistencia vascular en las circulaciones coronaria, cerebral y renal, con un efecto menor en la piel y el músculo.

- Incluyen dolor de cabeza
- Náuseas
- Rubor
- Hipotensión
- Palpitaciones,
- Taquicardia
- Diarrea y angina de pecho

# Vasodilatadores

## Nitroprusiato sódico

Era eficaz para mejorar la función cardiaca en pacientes con insuficiencia ventricular izquierda.

### Mecanismo de acción

- El nitroprusiato es un nitrovasodilatador que actúa liberando NO.
- El NO activa la ruta de la guanilciclasa-guanosina monofosfato cíclico-proteína cinasa G, lo que lleva a la vasodilatación, imitando la producción de NO por las células endoteliales vasculares, que está alterada en muchos pacientes hipertensos

### Farmacocinética

- El medicamento debe estar protegido de la luz y administrarse por infusión intravenosa continua para que sea efectivo.
- Su inicio de acción es dentro de 30 segundos; el efecto hipotensor máximo se produce en 2 min, y cuando se detiene la infusión del fármaco, el efecto desaparece en 3 min.
- El nitroprusiato de sodio está disponible en viales que contienen 50 mg. Los contenidos del vial deben disolverse en 2-3 mL de dextrosa al 5% en agua.

### Usos terapéuticos

Se usa principalmente para tratar emergencias hipertensivas, pero también se puede usar en situaciones donde se desea una reducción a corto plazo de la precarga o la poscarga cardiaca.

Se ha utilizado para disminuir la presión arterial durante la disección aórtica aguda; para mejorar el gasto cardiaco en la insuficiencia cardiaca congestiva, especialmente en pacientes hipertensos con edema pulmonar que no responde a otro tratamiento.

### Efectos adversos

Los efectos adversos a corto plazo del nitroprusiato se deben a una vasodilatación excesiva, a una hipotensión y a sus consecuencias.

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

En pacientes con insuficiencia renal, el tiocianato puede eliminarse fácilmente mediante hemodiálisis.

# Antagonistas de Ca no dihidropiridínicos

son más selectivos como vasodilatadores

## Mecanismo de acción

Reducción de la  
afluencia de Ca

La activación simpática  
refleja con taquicardia  
leve mantiene o  
aumenta el gasto  
cardíaco en la mayoría  
de los pacientes que  
reciben  
dihidropiridinas

## Fármacos

El amlodipino, la  
felodipina, la isradipina,  
la nicardipina, la  
nifedipina, la nisoldipina  
y la nitrendipina

## Dosis

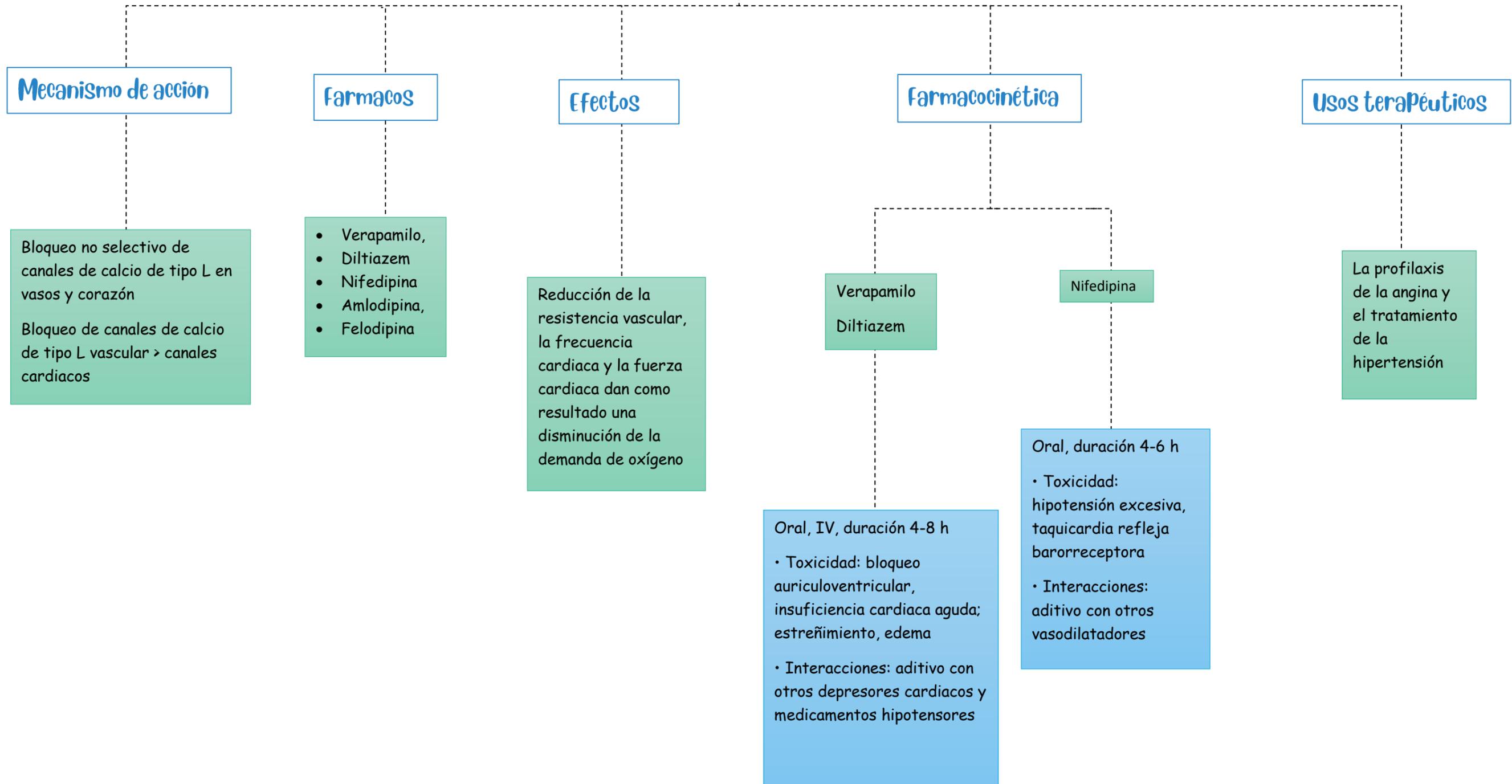
- La nicardipina intravenosa y la clevidipina están disponibles para el tratamiento de la hipertensión cuando la terapia oral no es factible;
- El verapamilo y el diltiazem parenterales también pueden usarse para la misma indicación. La nicardipina se infunde típicamente a dosis de 2-15 mg/h. La clevidipina se infunde a partir de 1-2 mg/h y progresa a 4-6 mg/h. Tiene un inicio de acción rápida y se ha utilizado en la hipertensión aguda que ocurre durante la cirugía.
- El nifedipino oral de acción corta se ha usado en el manejo de emergencia de la hipertensión severa.

## Usos terapéuticos

El verapamilo tiene el  
mayor efecto depresivo  
sobre el corazón y puede  
disminuir la frecuencia  
cardíaca y el gasto  
cardíaco. El diltiazem tiene  
acciones intermedias.

se recomienda que  
las dihidropiridinas  
orales de acción-  
corta no se utilicen  
para la hipertensión.

# Antagonistas de Ca dihidropiridínicos



## Bibliografía

1. Bertram G., K. T. (15a edición). FARMACOLOGIA BASICA Y CLINICA.
2. Gilman, G. &. (13a edición). LAS BASES FARMACOLÓGICAS DE LA TERAPÉUTICA.
3. GOODMAN & GILMAN LAS BASES DE FARMACOLOGÍA TERAPÉUTICA 13a EDICIÓN.  
LAURENCE L. BRUNTON, RANDA HILAL-DANDAN, BJORN, C. KNOLLMANN. PAG 514.
4. Thomas Eschenhagen. Tratamiento de la hipertensión. Vasodilatadores. Pag 518-520.  
Goodman y Gilman. Las bases farmacológicas de la terapéutica décimo tercera edición.