



# Mi Universidad

## Cuadro Sinóptico

*Nombre del Alumno:* **DANIELA DE LOS ANGELES RAMIREZ MANUEL**

*Nombre del tema:* **A. Locales, A. Opiáceos y Ansiolíticos**

*Parcial:* **II**

*Nombre de la Materia:* **TERAPEUTICA FARMACOLOGICA**

*Nombre del profesor:* **DR. JULIO ANDRES BALLINAS**

*Nombre de la Licenciatura:* **MEDICINA HUMANA**

*Semestre:* **CUARTO**

# Analgésicos Opiáceos

## PÉPTIDOS OPIOIDES ENDÓGENOS

- Principalmente las encefalinas, las endorfinas y las dinorfinas
- Los péptidos opioides se hallan en el plasma y reflejan la liberación de sistemas secretores como la hipófisis y las suprarrenales que no reflejan la liberación neuraxial

## RECEPTORES OPIOIDEOS

Los tres receptores opioides — $\mu$ ,  $\delta$  y  $\kappa$  (MOR, DOR y KOR)— pertenecen a la familia de GPCR de la rodopsina

- Un opioide es un compuesto que tiene las propiedades funcionales y farmacológicas de un opiáceo
- Los opioides representan el componente fundamental del tratamiento del dolor
- El tratamiento puede comprender antiinflamatorios no esteroides, anticonvulsivos o antidepresivos
- Los opioides comprenden los alcaloides, como la morfina, la codeína, la tebaína y muchos derivados semisintético

## CONSECUENCIAS FUNCIONALES

- Interiorización. La interiorización de los receptores  $\mu$  y  $\delta$  puede inducirse en forma diferencial como una función de la estructura del ligando
- Desensibilización. Cuando hay una activación transitoria (minutos a horas), ocurre tolerancia aguda o desensibilización que es específica para ese receptor
- Tolerancia. Se refleja por una reducción en el efecto máximo alcanzable o un cambio a la derecha en la curva dosis-efecto
- Dependencia. La dependencia representa un estado de adaptación que se manifiesta por un síndrome de abstinencia específico de clase de receptor y de fármaco producido por el cese de la exposición al fármaco
- Adicción. La adicción es un patrón de conducta que se caracteriza por la utilización compulsiva de un fármaco

## EFECTOS DE OPIOIDES

Producen diversos efectos compatibles con el papel que desempeñan los órganos y sistemas a los cuales se asocian los receptores por sus propiedades analgésicas

## MECANISMO DE ANALGESIA PROVOCADA POR OPIOIDES

Las acciones analgésicas de los opioides después de la administración sistémica representan acciones en el cerebro, la médula espinal y en algunos casos en la periferia

## FACTORES

- Riesgo de depresión respiratoria incluso en dosis terapéuticas
- Otros efectos: Crisis de epilepsia y convulsiones

## EFECTOS SECUNDARIOS Y PRECAUCIONES

La morfina y los opioides afines producen una amplia gama de efectos secundarios, entre ellos, depresión respiratoria, náuseas, vómitos, mareos, obnubilación, disforia, prurito, estreñimiento

# Analgésicos locales



## MECANISMO DE ACCION

- Actúan a nivel de la membrana celular para evitar la generación y la conducción de impulsos nerviosos
- Bloquean la conducción al disminuir o impedir el gran incremento transitorio de la permeabilidad de membranas excitables al sodio, que normalmente es producido por despolarización de la membrana



## EFFECTOS SECUNDARIOS

Interfieren en la función de todos los órganos en que se produzca la conducción o la transmisión de impulsos



## METABOLISMO

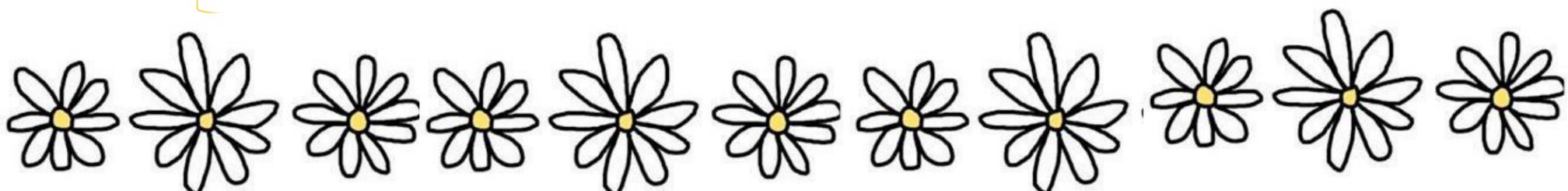
- Los anestésicos locales se unen de manera reversible a un receptor específico
- los anestésicos locales actúan en cualquier parte de tal sistema o en cualquier tipo de fibra nerviosa
- Los fármacos más utilizados hoy día son la procaína, la lidocaína, la bupivacaina y tetracaína

- Sus efectos tóxicos dependen en gran medida del equilibrio entre sus tasas de absorción y de eliminación
- La eliminación varía enormemente y es un factor importante para conocer la inocuidad de un fármaco particular
- Los efectos tóxicos dependen de la concentración del fármaco

## USOS CLINICOS

- Denota la insensibilidad de una zona corporal, sin que el sujeto pierda el conocimiento ni haya deficiencia en el control central de funciones vitales
- Se modifican de manera beneficiosa las respuestas neurofisiológicas al dolor y al estrés

- Anestesia tópica: Se utilizan la tetracaína (2%), la lidocaína (2 a 10%) y cocaína (1 a 4%), se absorben rápidamente en la circulación después de su aplicación local en las mucosas o la piel denudada
- Anestesia raquídea: Inyección de un anestésico local en el líquido cefalorraquídeo (LCR) en el espacio lumbar
- Anestesia epidural: un anestésico local inyectable, en el espacio epidural (espacio limitado por el ligamento amarillo en sentido posterior). Sitio primario de acción son las raíces de nervios raquídeos. Por vía epidural pueden actuar en la médula espinal y nervios paravertebrales
- Anestesia regional intravenosa (bloqueo de Bier): La técnica en este caso depende del uso de los vasos para llevar la solución anestésica a los troncos nerviosos y sus terminaciones. La anestesia regional intravenosa se utiliza más a menudo para operaciones del antebrazo y la mano, pero se puede adaptar al pie y zona distal de la pierna



# Ansiolíticos

- Los fármacos primarios contra los trastornos de ansiedad comprenden SSRI, SNRI, benzodiazepinas, buspirona y antagonistas adrenérgicos  $\beta$
- Las benzodiazepinas son ansiolíticos eficaces para el tratamiento con una sola administración y por largo tiempo
- Actúa, por medio del sistema serotoninérgico, en el cual se desempeña como agonista parcial a nivel de los receptores 5HT<sub>1A</sub>

## CONSIDERACIONES CLINICAS

- Las benzodiazepinas y los antagonistas adrenérgicos  $\beta$  son eficaces como productos únicos e inmediatos
- Las benzodiazepinas, como el alprazolam, el clordiazepóxido, el clonazepam, el clorazepato, el diazepam, el lorazepam y el oxazepam, son eficaces para tratar el trastorno de ansiedad generalizada, el trastorno de pánico y la ansiedad situacional
- Los fármacos de esa categoría también deterioran el rendimiento cognitivo y la memoria, afectan de manera adversa el control motor y potencian los efectos de otros sedantes

- Los efectos ansiolíticos de esa categoría de fármacos son mediados por interacciones alostéricas con el complejo del receptor GABA<sub>A</sub>
- El uso de este tipo de fármacos para tratar la ansiedad conlleva la posibilidad de crear hábito, dependencia y abuso
- La abstinencia de las benzodiazepinas después de su uso por largo tiempo, en particular aquellas cuya acción dura poco, incluye intensificación de la ansiedad y convulsiones

- Las benzodiazepinas ocasionan muchos efectos secundarios que incluyen sedación, deficiencia leve de la memoria, disminución del estado de alerta
- Otras reacciones patológicas comprenden irritabilidad, agresión o desinhibición conductual

- Los medicamentos de esta clase son más inocuos que los clásicos sedantes-hipnóticos en casos de sobredosificación y, de modo típico, son letales sólo si se les combina con otros depresores del SNC



## **Bibliografía**

Manuel de farmacología y terapéutica. Goodman y Gilman., 2da edición.