



UNIVERSIDAD DEL SURESTE  
CAMPUS COMITÁN  
LICENCIATURA EN MEDICINA HUMANA



# FARMACOLOGIA

MAPA CONCEPTUAL

## “AGONISTAS Y ANTAGONISTAS DEL RECEPTOR MUSCARINICO/ADRENERGICO”

DOCENTE: DR. ALFONZO MALDONADO YANETH DEL ROCIO

JORGE ALBERTO HILERIO GONZALEZ

GRADO: 3ro GRUPO: A

14 DE JUNIO DEL 2022

# MUSCARÍNICOS

## INTRODUCCION:

Los fármacos dirigidos a los receptores muscarínicos tienen una gran variedad de aplicaciones terapéuticas. Por ejemplo, se utilizan los agonistas muscarínicos para tratar la retención urinaria y la xerostomía; se emplean los antagonistas muscarínicos en el tratamiento de la vejiga hiperactiva, la enfermedad pulmonar obstructiva crónica y la hipermotilidad del tubo digestivo, y los dos grupos de fármacos tienen aplicaciones importantes en oftalmología. La clonación de cinco diferentes subtipos de receptor muscarínico y su delección genética subsiguiente en los ratones ha dado lugar a expectativas alentadoras en cuanto a que se podría mejorar bastante la utilidad terapéutica de fármacos que interactúan con los receptores muscarínicos mediante el desarrollo de agonistas y antagonistas selectivos de subtipo.

Al dirigirse a subgrupos específicos de receptores que controlan las respuestas muscarínicas en un órgano específico, se podrían evitar los efectos adversos que suelen caracterizar el empleo de estos fármacos. Los agonistas y los antagonistas de receptor muscarínico selectivos de subtipo muestran perspectivas favorables para el tratamiento de los trastornos del sistema nervioso central, como la enfermedad de Alzheimer y la enfermedad de Parkinson. Aunque ha sido difícil lograr la selectividad absoluta, el desarrollo de moduladores alostéricos permitirá en el futuro una mayor selectividad y nuevas aplicaciones terapéuticas.

## Agonistas y antagonistas del receptor muscarinico

Receptores muscarinicos en el sistema nervioso periferico se encuentran en celulas efectoras autonomicas inervadas por nervios parasimpaticos postganglionares, ganglios autonomicos

Agonistas muscarinicos imitan los efectos de ACh

Propiedades y subtipos de los receptores muscarinicos

Caracterizados por el analisis de las respuestas de las celulas y los sistemas de organos periferia y el CNS

Receptores muscarinicos M1 A M5 son receptores acoplados a la proteina G

M1.M3, M5 provoca la hidralisiside polifosfositos y la movilicacion de Ca

M2 y M4 inhiben la adenill ciclasa y regula canales ionicos especificos

Sitio de union muscarinicos ortosterico para agonistas y antagonistas estan conservado entre los subtipos de receptores muscarinicos

Ampliamente distribuidos en el CNS y en los tejidos perifericos

Los agentes alostericos pueden activar directamente de los recptores se denominan agonistas alostericos

# Efectos farmacologicos de la aceticolina

## Sistema cardiovascular

Vasodilatacion  
Disminucion de la frecuencia cardiaca  
Velocidad de conduccion en el nodo AV  
Disminucion de la fuerza de la contraccion cardiaca

## Tracto urinario

Control de la contraccion de la vejiga M3  
Contracciones de la vejiga indirectamente al invertir la relajacion M2

## OJO

Miosis al contraer el musculo del esfiter pulmonar , acomodamiento para la vision cercana  
Receptores muscarincos M3

## Sistema respiratorio

Bascontriccion, aumento de la secrecion traqueobranquial y estimulacion de quimiorreceptores Muscarinicos M3

## Efectores secretores

Secrecion de glandulas que reciben la inervacion colinergicva parasimpatica o simpatica, glandulas nasofarigueas, lagrimales, salivales y sudoriparas

## CNS

Los cinco muscarinicos se expresan en el cerebro pueden tener un papel importante en la funcion cognitiva, el control motor y la regulacion del apetito

## Agonistas del receptor muscarínico

Jorge Alberto Hilerio González

Se divide en Esteres en colina y varios esterés sintéticos  
Alcaloides colinomiméticos naturales y sus congéneres sintéticos

### ADME

La muscarina y los esterés son aminos cuaternarios  
Pilocarpina y acetilcolina son terciarios :Absorben fácilmente la barrera hematoencefálica

Esterés de colina aminos cuaternarios, se absorben poco después de la administración oral, capacidad limitada puede atravesar la barrera hematoencefálica

### Usos terapéuticos de agonistas receptores muscarínicos

Se utilizan en tratamiento de trastornos de la vejiga urinaria y xerostomía y en el diagnóstico de hiperreactividad bronquial

**Acetilcolina**  
Se usa tópicamente para la inducción de la miosis durante la cirugía oftálmica, como una solución al 1%

**Metacolina:**  
Se administra por inhalación de hiperreactividad de las vías respiratorias en pacientes que no tienen asma clínicamente aparente

**Pilocarpina**  
Tratamiento de xerostomía, tratamientos de cabeza y cuello, se utiliza tópicamente en oftalmología para el tratamiento de glaucoma y agente mitótico

**Betanecol:**  
Afecta tracto urinario, utilidad en el tratamiento de la retención urinaria y el vaciado inadecuado de la vejiga cuando no existe obstrucción orgánica

**Cevimeline:**  
Agonista activa los receptores M1 y M2 en los epitelios lagrimales y de las glándulas salivales  
Acción de larga duración, dosis habitual es de 30 mg tres veces al día

**Carbacol**  
Se usa en oftalmología para el tratamiento del glaucoma y la inducción de la miosis durante la cirugía; se instila en el ojo como una solución al 0.01-3

### Contraindicaciones, precauciones y efectos adversos

Consecuencias predecibles de la estimulación del receptor muscarínico  
Asma, enfermedad pulmonar obstructiva crónica, obstrucción urinaria o del tracto GI, enfermedad acidopéptica, enfermedad cardiovascular

### TOXICOLOGÍA

Toxicología  
Envenenamiento por ingestión de plantas que contienen pilocarpina, muscarina o arecolina.  
Tratamiento consiste en la administración parenteral de atropina

## Antagonistas de receptores muscarínicos

Atropina, escopolamina  
Derivados semisintéticos de estos alcaloides  
Derivados sintéticos

### Efectos farmacológicos de los antagonistas muscarínicos

#### Mecanismo de acción

Atropina y los compuestos relacionados compiten con la acetilcolina y otros agonistas muscarínicos

Antagonismo por atropina es competitivo  
Los antagonistas inhiben las respuestas a la estimulación nerviosa colinérgica posganglionar

Efecto de la atropina, proporcionan una buena base para comprender los usos terapéuticos de los diversos antagonistas muscarínicos

Los antagonistas de los receptores muscarínicos bloquean las respuestas colinérgicas del músculo del esfínter pupilar del iris y del músculo ciliar controlando la curvatura de la lente

La atropina puede inhibir la broncoconstricción causada por la histamina, la bradicinina y los eicosanoides

Receptores antiespasmódicos para trastornos GI y para reducir la secreción de ácido gástrico en el tratamiento de la úlcera péptica



# ADRENERGICOS

## INTRODUCCION

En este mapa abordaremos el tema del capítulo Agonistas y antagonistas adrenérgicos, que como ya sabemos un agonista es el que ejerce efectos similares o idénticos a los de la epinefrina. Los cuales se clasifican en dos grupos: Simpaticomiméticos de acción directa, de acción indirecta o acción mixta, a diferencia de un antagonista adrenérgico que. Es conocido por ser un fármaco que actúa inhibiendo la acción de los receptores adrenérgicos. Encontramos una extensa gama de fármacos dando Dado que la NE tiene un efecto más pronunciado sobre los receptores  $\alpha$  y  $\beta_1$  que sobre los receptores  $\beta_2$ , muchos fármacos distintos de las catecolaminas la liberación de NE está mediada principalmente por el corazón y los receptores  $\alpha$ . Sin embargo, ciertos compuestos distintos de las catecolaminas tienen efectos directos e indirectos sobre los receptores. Sin dudas, la mayor actividad simpaticomimética se produce cuando dos átomos de carbono separan el anillo del grupo amino. Esta regla se aplica, con pocas excepciones, a todos los tipos de acción. Se ha demostrado que los antagonistas del receptor adrenérgico  $\alpha_1$  Al mejorar la obstrucción del flujo sanguíneo de la vejiga se disminuyen Síntomas obstructivos e irritantes. Aunque se sabe que el receptor  $\alpha_1$  es responsable de la Relajación del músculo liso de la próstata, el mecanismo para mejorar los síntomas.

# AGONISTAS Y ANTAGONISTAS ADRENÉRGICOS

catecolaminas y fármacos simpaticomiméticos

Están compuestos por 7 tipos acciones

acción excitadora periférica que actúan en ciertos tipos de músculo liso, como aquellos en los vasos sanguíneos que irrigan la piel, los riñones y las membranas mucosas, y en células glandulares

acción inhibitoria periférica sobre ciertos tipos de músculo liso, Una acción excitadora cardíaca que aumenta la frecuencia cardíaca y la fuerza de contracción.

Acción excitadora cardíaca Aumenta la frecuencia cardíaca y la fuerza de contracción

Acciones metabólicas como por ejemplo aumento en la tasa de glucogenólisis en el hígado y los músculos.

Acciones endocrinas tales como la modulación de la liberación de insulina

Acciones en el sistema nervioso central de las cuales se remarca como ejemplo, la reducción del apetito

Acciones presinápticas las cuales Inhiben como facilitan la liberación de neurotransmisores

Clasificación de los fármacos simpaticomiméticos

DIRECTA

Las cuales Actúan sobre 1 o más receptores adrenérgicos, las respuestas no se reducen con un tratamiento previo con reserpina o guanetidina y puede potenciarse con cocaína, reserpina y guanetidina

INDIRECTA

que Aumentan la disponibilidad de la Norepinefrina o la Epinefrina. Contiene tantos agentes liberadores de anfetaminas e Inhibidor de la captación, MAO y COMT

MIXTA

los cuales son conocidos por que liberan norepinefrina de modo indirecto y también activan directamente los receptores, en los que La respuesta se reduce con un tratamiento previo con reserpina o guanetidina

Base fisiológica de la respuesta adrenérgica

Existen Factores importantes en la respuesta a las aminas simpaticomiméticas como la activación de los receptores  $\beta_2$ , la densidad y la proporción relativa de los receptores adrenérgicos  $\alpha$  y  $\beta$  y la Activación de receptores  $\alpha$

Concepto de falso transmisor

Se produce Cuando el nervio es estimulado, el contenido de vesículas sinápticas se libera por exocitosis Si estas vesículas contienen feniletilaminas mucho menos potentes que la NE

## CATECOLAMINAS ENDÓGENAS

### Norepinefrina

Liberado por los nervios simpáticos posganglionares

La noradrenalina es un importante mediador químico liberado por los nervios simpáticos posganglionares en los mamíferos. Se diferencia del EPI solo en la falta de sustitución de metilo en el grupo amino

Constituye entre 10 y 20% del contenido de catecolaminas de la médula suprarrenal

### Epinefrina

La adrenalina es un potente estimulante de los receptores adrenérgicos  $\alpha$  y  $\beta$  y, por lo tanto, sus efectos sobre los órganos diana son complejos.

Proporciona alivio rápido y de emergencia, en caso de reacciones de hipersensibilidad.

### Dopamina

Precursor metabólico inmediato de la NE y la EPI

es un neurotransmisor central de especial importancia en la regulación del movimiento y tiene importantes propiedades farmacológicas intrínsecas

En la periferia, se sintetiza en las células epiteliales del túbulo proximal y se cree que tiene efectos diuréticos y natriuréticos locales.

Puede mejorar de forma importante la función cardíaca y renal en pacientes gravemente enfermos

## Agonistas de los receptores adrenérgicos $\alpha$

Agonistas selectivos de los receptores adrenérgicos  $\alpha_1$

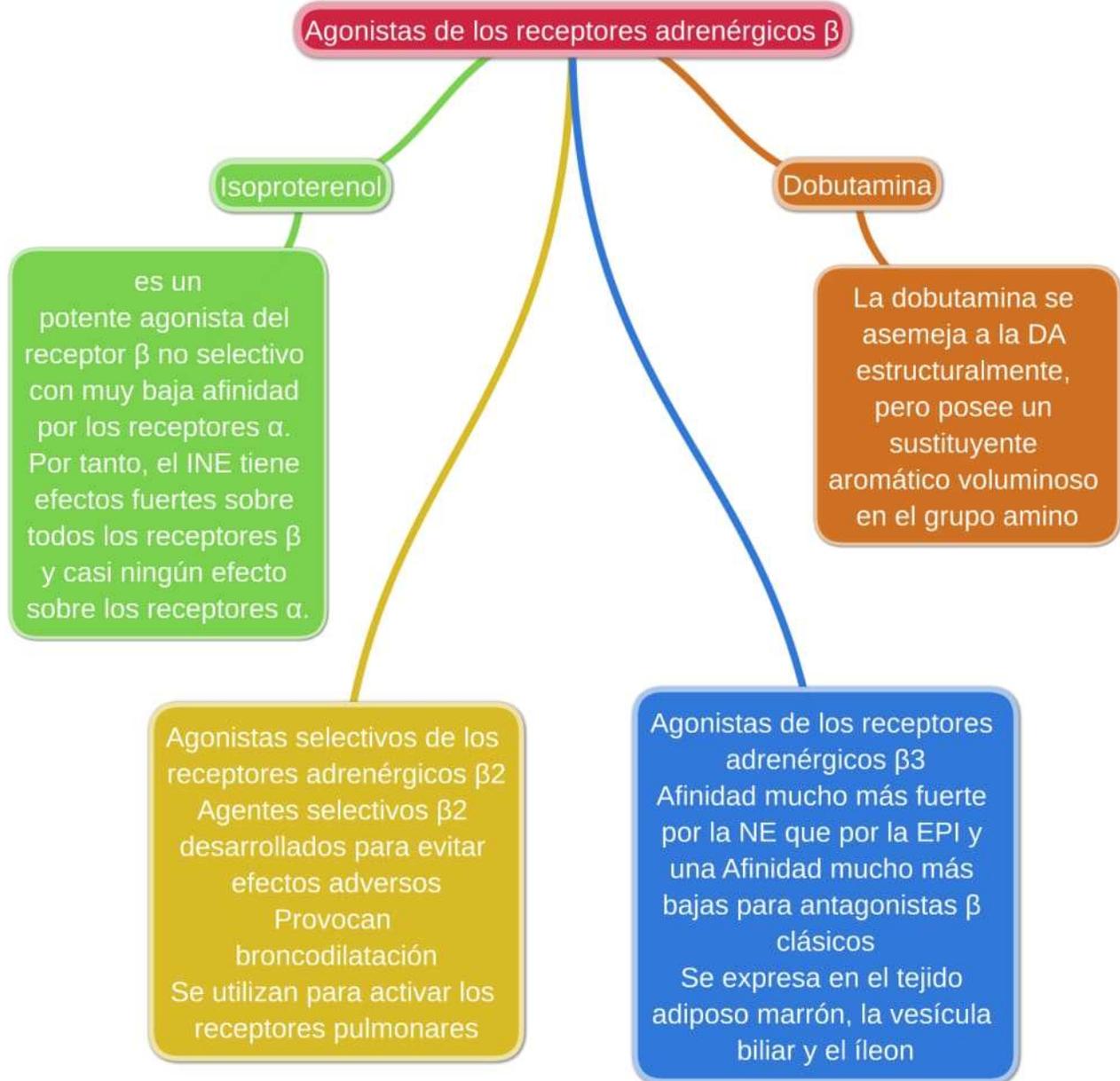
Aumenta la resistencia vascular periférica

Tratamiento de pacientes con hipotensión entre estos contamos con Fenilefrina, Metaraminol, Midodrina

Agonistas selectivos de los receptores adrenérgicos  $\alpha_2$

Perfectos Para el tratamiento de la hipertensión sistémica

Reducen la presión intraocular, al disminuir la producción de humor



# Agonistas simpaticomiméticos diversos

## Metilfenidato

es un derivado de la piperidina relacionado estructuralmente con la anfetamina. El metilfenidato es un estimulante suave del SNC, con efectos más importantes en las actividades mentales que motoras

Sin embargo, las dosis altas producen signos de estimulación generalizada del SNC, que pueden provocar convulsiones.

## Pemolina

La pemolina difiere en estructura del metilfenidato, pero causa cambios similares en la función del SNC, con efectos mínimos sobre el sistema cardiovascular

## Anfetamina

La anfetamina, racémica - fenilisopropilamina, tiene potentes acciones estimulantes del SNC además de las acciones  $\alpha$  y periféricas comunes a los fármacos simpaticomiméticos de acción indirecta.

## Metanfetamina

La metanfetamina guarda una relación química cercana con la anfetamina y la efedrina.

Usos terapéuticos de los fármacos simpaticomiméticos

Hipertensión

Los agonistas del receptor  $\alpha_2$  que actúan centralmente, como la clonidina, son útiles en el tratamiento de la hipertensión

Arritmias cardiacas

El tratamiento farmacológico puede facilitar la reanimación cardiopulmonar en pacientes con paro cardiaco debido a fibrilación ventricular, disociación electromecánica o asistolia.

Insuficiencia cardiaca congestiva

La estimulación simpática de los receptores  $\beta$  en el corazón parece ser un mecanismo compensador importante para mantener la función cardiaca en pacientes con insuficiencia cardiaca congestiva. Sin embargo, el corazón que falla no responde bien a una estimulación simpática excesiva.

Choque

El choque es un síndrome clínico caracterizado por una perfusión inadecuada de los tejidos; por lo general, se asocia con hipotensión y, en última instancia, con el fallo de los sistemas orgánicos.

Reacciones alérgicas

La epinefrina es el fármaco de elección para revertir las manifestaciones de reacciones de hipersensibilidad graves y agudas.

Asma

El uso de agonistas adrenérgicos  $\beta$  en el tratamiento del asma y la COPD

Reducción de peso

La anfetamina promueve la pérdida de peso al suprimir el apetito en lugar de aumentar el gasto de energía

Trastorno por déficit de atención o hiperactividad

se caracteriza por una actividad motora excesiva, dificultad para mantener la atención e impulsividad.

## **BIBLIOGRAFÍA:**

Brunton, L., Lazo, J., y Keith, P (2018). Goodman y Gliman. Las bases farmacológicas de la terapéutica. 13° edición. Editorial McGraw Hil.

Brunton, L./ Hilal-Dandan, R/ Knollmann, B. (2019). LAS BASES FARMACOLOGICAS DE LA TERAPEUTICA. (Decimo tercera edición). Editorial: McGRAW-HILL INTERAMERICANA EDITORES, S.A. DE C.V.