

Anestésicos ANSIOLITICOS

Farmacocinetica

Absorción rápida y completa por vía oral excepto clorazepato
Se distribuye por todo el organismo, atraviesan barreras.
Se metabolizan ampliamente en el hígado, donde se forman varios metabolitos que se eliminan en la orina. Su vida media de eliminación es de 8 a 20 h.
Se eliminan principalmente por orina. La vida media se alarga en pacientes ancianos, enfermedad hepática y prematuros. La vida media es variable. Ejemplo: DIAZEPAM 20 a 100 hrs

Farmacodinamia

Se unen a sitios específicos en el receptor a GABA, aumentan la conductancia del cloro e hiperpolarizando aún más a la neurona, potenciando los efectos del gamma-aminobutirato (GABA) y otros neurotransmisores inhibitorios.

Conjunto de psicofármacos encargados de reducir la ansiedad, tensión emocional, inquietud interna y angustia psíquica. Son fármacos sumamente eficaces para la mejora de muchos trastornos de ansiedad.

Los principales fármacos ansiolíticos son las benzodiazepinas.
Pueden tener diversos efectos terapéuticos y en relación al que predomine en cada una de ellas hablaremos de benzodiazepinas de acción ansiolítica, sedante, relajante muscular, hipnótica y antiepiléptica

Anestésicos LOCALES

Farmacocinetica

Farmacodinamia

Fármacos capaces de bloquear de manera reversible la conducción del impulso nervioso en cualquier parte del sistema nervioso a la que se apliquen, originando una pérdida de sensibilidad y siendo la recuperación de la función nerviosa completa una finalizado su efecto.

Su absorción depende tanto de la dosis, como de la concentración y de la vascularización del tejido donde se administre. Así la vía subcutánea es la que presenta menor absorción. Esta se incrementa siguiendo la siguiente pauta: ciática, plexo braquial, epidural, paracervical, intracostal, traqueal e intravenosa.

Se describen típicamente por su potencia, duración de la acción, velocidad de aparición y tendencia al bloqueo diferencial de los nervios sensoriales. Estas propiedades no se clasifican de forma independiente.

Se describen típicamente por su potencia, duración de la acción, velocidad de aparición y tendencia al bloqueo diferencial de los nervios sensoriales. Estas propiedades no se clasifican de forma independiente.

El metabolismo de este grupo terapéutico de tipo éster son metabolizados por las esterasas plasmáticas, pseudocolinesterasas y hepáticas, produciéndose el PABA. Los AL tipo amida se metabolizan en el hígado (la prilocaína también en los pulmones).

La potencia bloqueadora de los nervios de los LA aumenta con el aumento del peso molecular y el aumento de la solubilidad en lípidos. Los LA más grandes y lipófilos penetran las membranas nerviosas más fácilmente y se unen a los canales de Na con mayor afinidad.

Grupo hidrofóbico: un anillo aromático, determinante de la liposolubilidad, difusión y fijación de la molécula. La liposolubilidad del fármaco determina la potencia farmacológica: a mayor liposolubilidad mayor potencia.

Grupo hidrofílico: una amina secundaria o terciaria, que modula la hidrosolubilidad y por consiguiente su difusión sanguínea e ionización.

La distribución de los anestésicos locales son más prolongadas en los tejidos altamente vascularizados, seguidos por los tejidos menos vascularizados y la grasa. Los ésteres se unen a las proteínas en menor medida que las amidas. La insuficiencia renal aumenta la acumulación de anestésicos locales.

La duración de acción esta relacionada con la capacidad de unión a las proteínas de la molécula de anestésico local así como también su capacidad vaso dilatadora

La latencia, el inicio de acción de AL esta condicionado por el pKa de cada farmaco

Cadena intermedia con un enlace de tipo éster o amida, responsable de la velocidad de metabolización del fármaco y, por tanto, determinante de la duración de la acción y su toxicidad.

Se excretan por los riñones, la excreción de amidas depende del metabolismo hepático:

- La reducción del flujo sanguíneo hepático provoca la acumulación de metabolitos.
- Las enfermedades críticas pueden reducir el flujo sanguíneo al hígado y provocar la acumulación de metabolitos.
- Los metabolitos se acumulan en individuos con disfunción renal.

Anestésicos OPIOIDES

Farmacocinética

Absorción

- Pueden administrarse en preparados parenterales, orales, por insuflación nasal y transdérmicos
- La mayoría se absorben bien

Distribución

- La unión a proteínas varía
- Se localizan en tejidos muy perfundidos:
 - Cerebro
 - Pulmones
 - Hígado
 - Riñones
 - Bazo

- La acumulación puede ocurrir en:

- Músculo esquelético
- Tejido adiposo

Metabolismo y excreción

- Metabolismo de 1er paso significativo y variable
- La mayoría de los opioides son metabolizados por:
 - CYP3A4
 - CYP2D6
 - Glucuronidación hepática
- Excreción: renal

Farmacodinamia

Provocan analgesia al unirse a receptores específicos acoplados a proteínas G, ubicados principalmente en regiones de SNC (Cerebro, Tálamo, Sistema Límbico y médula espinal) implicadas en la transmisión y modulación del dolor. Modulan la sensación emocional subjetiva al dolor y disminuyen su impacto en el individuo, creando una especie de indiferencia

Farmacos opioides son una clase de medicamentos naturales o sintéticos que actúan sobre los receptores opioides para proporcionar analgesia y efectos en el sistema nervioso central (SNC).

Existen 3 receptores opioides clásicos situados en el sistema nervioso central y periférico:

- Mu
- Kappa
- Delta

- Agonistas
- Agonistas parciales: tienen ↑ afinidad por el receptor, pero ↓ la eficacia del receptor
- Agonistas-antagonistas: pueden tener efectos agonistas y antagonistas en diferentes receptores opioides

Anestésicos NEUROLEPTICOS

Farmacocinetica

Se administran VO, sufren 1er paso hepático (el % es variable) y llegan fácilmente al cerebro. Existen preparaciones de liberación lenta para la administración IM que duran hasta 3 semanas, y son útiles en Px que no cumplen el TX.
Distribución: No es uniforme, la drog se acumula en cerebro, pulmón y otros tejidos con gran irrigación. En cerebro puede tener una concentración 10 veces mayor que en la sangre
Metabolismo: es hepático, por el sistema P-450 por oxidación microsomal y conjugación con ácido glucurónico.
Excreción: los metabolitos se eliminan principalmente por orina y en menor proporción por bilis.

Farmacodinamia

El mecanismo de acción de las drogas neuro-lépticas, se relaciona posiblemente con las causas orgánicas, genéticas, gestacionales u otras, que determinan la esquizofrenia y otras psicosis

Los neurolépticos son fármacos que ejercen efectos fundamentalmente sobre el sistema dopaminérgico. Este último tiene un importante papel en la regulación de la vida emocional y en el control de la motivación, en la modulación de la percepción, así como en la organización de los comportamientos adaptativos

Su función es aliviar, disminuir y controlar los síntomas psicóticos, tales como los delirios, las alucinaciones y el lenguaje y comportamiento desorganizado que provoca esta enfermedad.

Grupos de fármacos que pueden inducir una remisión de la psicosis (no son curativos, mejoran síntomas). Permiten que el paciente con esquizofrenia se integre en la sociedad; sin embargo, no logran devolverlo completamente a su estado premórbido.

También llamados antipsicóticos clásicos, típicos o tranquilizantes mayores, se identifican bajo el término de neurolépticos

Es lo mismo antipsicótico y neuroléptico? - Antipsicótico: denota la capacidad de los fármacos para aliviar la psicosis. - Neuroléptico: denota los efectos adversos neurológicos de los antipsicóticos, resultado del bloqueo del receptor D2 en el estriado (el principal es el parkinsonismo). Podríamos reservar este término para los fármacos antipsicóticos que tienen predominantemente efectos adversos.

Anestésicos ANTIDEPRESIVOS

Farmacocinetica

Los ATC son drogas liposolubles con absorción facilitada por vía oral. El peak plasmático se suele registrar entre las 6 y 12 horas, con un importante efecto de primer paso hepático. La unión a proteínas es muy alta y la distribución, universal. Su metabolismo es esencialmente hepático, mientras que la mitad de una dosis se elimina a los 2 a 3 días por vía renal. La vida media de la amitriptilina es de 20-30 horas y la de la Imipramina 10-20 horas. existencia de vías metabólicas, fundamentalmente desmetilación e hidroxilación aromática, que determinan en algunos casos la formación de metabolitos dotados de actividad farmacológica

Farmacodinamia

La mayor parte de los antidepresivos actúan sobre la recaptación de monoaminas. La acción inhibitoria sobre la recaptación de noradrenalina o 5-HT conduce a un incremento de estas aminas en el espacio sináptico, gracias al cual se produce el efecto antidepresivo. Los antidepresivos cíclicos bloquean la reabsorción (recaptación) de los neurotransmisores serotonina y norepinefrina, lo cual aumenta los niveles de estos dos neurotransmisores en el cerebro. Los antidepresivos cíclicos también afectan a otros neurotransmisores, lo cual puede producir diversos efectos secundarios.

Los antidepresivos ayudan a restablecer el equilibrio normal de las sustancias químicas del cerebro y ayudan a regular el estado de ánimo. Cuando estas sustancias químicas del cerebro se encuentran en un equilibrio adecuado, usted podría experimentar una mejoría en su depresión.

Los antidepresivos se dividen clásicamente en tres clases: los inhibidores de la monoaminoxidasa (IMAO), los tricíclicos, y los de segunda generación,

Anestésicos RELAJANTES MUSCULARES

Farmacocinetica

Se refieren a la interferencia de una droga en los procesos de absorción, distribución, metabolismo y excreción de otra droga. Esta interacción modifica la concentración sanguínea de la droga y, por tanto, la disponibilidad de la droga activa para llegar a ponerse en contacto con los receptores.

Se absorbe rápidamente por vía oral, con una vida media de 3-4 horas. Se elimina principalmente por el riñón y el 15% es metabolizado en hígado. En pacientes con compromiso de la función renal, las dosis deben ser reducidas.

Farmacodinamia

Los relajantes musculares esqueléticos son fármacos que actúan sobre los centros nerviosos y deprimen la actividad del músculo esquelético, disminuyendo el tono y los movimientos involuntarios.

Resultan de la administración de dos o más fármacos con efectos similares (u opuestos), lo cual conlleva a la modificación de la respuesta por un mecanismo a nivel de receptores, enzimas u otros.

Se usa para relajar los músculos y reducir la tensión, la rigidez y el dolor causados por los espasmos musculares o la espasticidad muscular (músculos rígidos e inflexibles). Los relajantes musculares también se utilizan para evitar el movimiento durante las cirugía

Los relajantes musculares se clasifican en despolarizantes y no despolarizantes de acuerdo con su acción en los receptores. El único relajante despolarizante en uso es la succinilcolina