



Mi Universidad

Resumen

Nombre del Alumno: Yari karina Hernandez chacha

Nombre del tema: Antiemeticos de acción periferica

Parcial :2do

Nombre de la Materia: Medicina Paliativa

Nombre del profesor: Agenor Abarca Espinoza

Nombre de la Licenciatura: Medicina Humana

6to Semestre Grupo C

Antieméticos

Los antieméticos son medicamentos que se utilizan para tratar y/o prevenir las náuseas y los vómitos. Estos medicamentos actúan sobre diferentes receptores diana. Las clases principales incluyen benzodiazepinas, corticosteroides, antipsicóticos atípicos, cannabinoides y antagonistas de los siguientes receptores: serotonina, dopamina, muscarínicos y neuroquinina. Los anticolinérgicos y los antihistamínicos son eficaces en el tratamiento de las causas vestibulares de las náuseas. Los antagonistas de la serotonina y la neuroquinina son eficaces en el tratamiento de las náuseas y los vómitos inducidos por quimioterapia. Sin embargo, los antieméticos deben utilizarse con precaución debido a sus efectos adversos. Los antagonistas de la serotonina y algunos antagonistas de la dopamina provocan la prolongación del intervalo QT. Los antagonistas de la dopamina se asocian con síntomas extrapiramidales. Además, muchos agentes provocan sedación y tienen efectos anticolinérgicos, que pueden agravar las enfermedades subyacentes.

Clasificación

Las siguientes clases de medicamentos se utilizan como monoterapia o en combinación para la prevención y el tratamiento de las náuseas y los vómitos:

Antagonistas de los receptores de serotonina

Glucocorticoides

Anticolinérgicos

Antagonistas de los receptores de neuroquinina

Antagonistas de los receptores de dopamina

Cannabinoides

Antihistamínicos

Antipsicóticos atípicos

Benzodiazepinas

Indicaciones generales

Náuseas y vómitos inducidos por quimioterapia:

Fase aguda (dentro de las 24 horas)

Fase tardía (2-5 día)

Náuseas y vómitos inducidos por radiación

Náuseas y vómitos posoperatorios

Náuseas y vómitos relacionados con la migraña

Clasificación:

La zona gatillo quimiorreceptora es un área con altas concentraciones de receptores de serotonina (5-HT₃), dopamina (D₂) y opioides. Es una de las cuatro principales fuentes de impulsos aferentes al centro del vómito, en la formación reticular del tronco encefálico. Las demás son el sistema vestibular, relevante en la cinetosis por el nervio auditivo y rico en receptores muscarínicos (M₁) y para la histamina (H₁), el tubo digestivo por el nervio vago y las aferentes espláncicas por medio de la médula espinal, con receptores 5-HT₃ y que responden a la irritación de la mucosa, y el sistema nervioso central, por emesis por estrés, trastornos mentales o anticipatoria a quimioterapia. Generalmente, los antieméticos se clasifican con base en el receptor en el que ejercen su acción. No obstante, en algunos hay superposición de los mecanismos.

Los antagonistas selectivos de los receptores 5-HT₃ de serotonina tienen efectos antieméticos por el bloqueo de esos receptores en el tracto gastrointestinal y en la zona gatillo quimiorreceptora.

Clases de Medicamentos Antieméticos

Anticolinérgicos

La escopolamina es un ejemplo de un medicamento anticolinérgico que a menudo se usa para tratar el mareo por movimiento o las náuseas y los vómitos asociados con la recuperación quirúrgica de la anestesia y/o la analgesia opiácea.

Mecanismo de Acción

Los anticolinérgicos bloquean los receptores ACh en el centro vestibular y dentro del cerebro para prevenir estímulos inductores de náuseas a la zona desencadenante de quimiorreceptores (CTZ) y el Centro de Vómitos (VC). También secan las secreciones GI y reducen los espasmos del músculo liso.

Consideraciones específicas de administración

El parche transdérmico de escopolamina está diseñado para la liberación continua de escopolamina tras la aplicación en un área de piel intacta en la cabeza, detrás de la oreja. El sistema está formulado para administrar aproximadamente 1 mg de escopolamina a la circulación sistémica a lo largo de 3 días. Está contraindicado en pacientes con glaucoma. Se ha reportado que exacerba la psicosis, induce convulsiones y causa somnolencia, confusión y sedación. Debido a sus propiedades anticolinérgicas, la escopolamina puede disminuir la motilidad gastrointestinal y causar retención urinaria. Los enfermeros deben realizar un monitoreo más frecuente durante el tratamiento con Transderm Scōp e interrumpir Transderm Scōp en pacientes que desarrollen dificultad para orinar.

Antihistamínicos

La meclizina es un ejemplo de un antihistamínico que a menudo se usa para tratar el mareo por movimiento.

Mecanismo de Acción

Los antihistamínicos bloquean los receptores H1 en el centro vestibular y también pueden bloquear la acetilcolina (ACh).

Consideraciones específicas de administración

Los antihistamínicos están contraindicados en pacientes con glaucoma o glándula prostática agrandada. La dosis debe iniciarse una hora antes de que comience el viaje.

Enseñanza y educación del paciente

No exceda la dosis recomendada.

Tenga en cuenta que puede ocurrir somnolencia.

Evite el alcohol, los sedantes y los tranquilizantes, que pueden aumentar la somnolencia.

Evite las bebidas alcohólicas.

Tenga cuidado al conducir un vehículo motorizado o operar maquinaria. [10]

Antagonistas dopamina

La proclorperazina es un ejemplo de un antagonista de dopamina utilizado para tratar las náuseas y los vómitos. También se puede utilizar como medicamento antipsicótico.

Mecanismo de Acción

La proclorperazina bloquea la dopamina en la zona de activación de quimiorreceptores (CTZ). También calma el sistema nervioso central y también puede bloquear la acetilcolina.

Consideraciones específicas de administración

La proclorperazina se puede administrar por vía oral, intramuscular, rectal o intravenosa. Está contraindicado en niños menores de 2 años o menores de 20 libras. Se han producido efectos secundarios graves cuando se usa para tratar la psicosis.

Enseñanza y educación del paciente

Se debe indicar a los pacientes que tomen los medicamentos según lo prescrito. Deben evitar el alcohol y otros depresores del SNC.

Procinéticos

La metoclopramida es un ejemplo de un medicamento procinético

Foto de viales de metoclopramida, un procinético

Figura 7.16 Procinéticos

Mecanismo de Acción

La metoclopramida bloquea la dopamina y también puede sensibilizar los tejidos a la acetilcolina. Se utiliza para promover la peristalsis para vaciar el tracto gastrointestinal y así reducir las náuseas.

Consideraciones específicas de administración

La metoclopramida se puede administrar por vía oral, intramuscular e intravenosa. El inicio de la acción farmacológica de la metoclopramida es de 1 a 3 minutos después de una dosis intravenosa, de 10 a 15 minutos después de la administración intramuscular y de 30 a 60 minutos después de una dosis oral. Los efectos farmacológicos persisten de 1 a 2 horas.

La metoclopramida no debe usarse siempre que la estimulación de la motilidad gastrointestinal pueda ser peligrosa (p. ej., en presencia de hemorragia gastrointestinal, obstrucción mecánica o perforación). La metoclopramida está contraindicada en pacientes

con feocromocitoma debido a que el medicamento puede causar una crisis hipertensiva. La metoclopramida no debe usarse en epilépticos o pacientes que reciben otros fármacos que puedan causar reacciones extrapiramidales debido a que la frecuencia y gravedad de las convulsiones o reacciones extrapiramidales pueden aumentar. Se han presentado reportes raros de síndrome neuromaligno

TABLA I. PRINCIPALES ANTIEMÉTICOS

MEDICAMENTO MECANISMO DE ACCIÓN	COMENTARIOS
ANTICOLINÉRGICOS Escopolamina <i>Bloqueo anticolinérgico</i>	Los receptores colinérgicos (y los de histamina) parecen muy relacionados con la transmisión de impulsos del órgano del equilibrio y poco o nada con otros mecanismos excitatorios del vómito. La escopolamina se usa en mareo cinético. Su inconveniente son los efectos secundarios anticolinérgicos.
ANTI-HISTAMÍNICOS Dimenhidrinato Meclozina. Otros en el grupo R06A <i>Bloqueo mixto de receptores H₁ de histamina y M de acetilcolina.</i>	Muy usados en mareo cinético. Menos potentes que la escopolamina pero con menos efectos adversos (anticolinérgicos, somnolencia).
FENOTIAZINAS Clorpromazina y otros del grupo N05A Tietilperazina BUTIROFENONAS Haloperidol (grupo N05A) <i>Bloqueo de receptores dopaminérgicos</i>	Las fenotiazinas son antieméticos de uso general, eficaces en una gran variedad de estímulos de intensidad baja o moderada. No son eficaces en vómitos por eméticos potentes, como la quimioterapia con cisplatino. Parece existir una relación dosis/efecto pero los efectos secundarios limitan la dosis máxima. Estos efectos son reacciones distónicas (sobre todo en niños), sedación e hipotensión. Las butirofenonas son más potentes como antieméticos pero también producen más efectos adversos.
ORTOPRAMIDAS Metoclopramida y otras del grupo A03F Levosulpirida <i>Bloqueo de receptores serotoninérgicos y/o dopaminérgicos</i>	Actúan como agonistas de los receptores serotoninérgicos periféricos 5-HT ₄ (actividad procinética) y/o antagonistas de los dopaminérgicos D ₂ centrales (actividad antiemética). Los efectos antieméticos podrán potenciarse por el antagonismo de los receptores 5-HT ₃ de la zona gatillo, aunque esto sólo se da a altas dosis. Las ortopramidas comparten muchas de las propiedades e inconvenientes de las fenotiazinas (incluyendo las reacciones extrapiramidales) pero tienen un mecanismo de acción más complejo y son preferibles en ciertos casos. La metoclopramida en dosis altas (1-3 mg/kg) era el antiemético más potente disponible para vómitos por quimioterapia hasta que apareció ondansetrón. La levosulpirida solo tiene acción antidopaminérgica (D ₂)
ANTISEROTONÉRGICOS Granisetron Ondansetrón Palonosetrón <i>Bloqueo de receptores serotoninérgicos 5-HT₃</i>	Forman el grupo de antieméticos más potente disponible para vómitos de quimioterapia, y posiblemente muy eficaces también en vómitos postoperatorios y por radioterapia. Con todo, la eficacia es mayor en vómitos inmediatos a la terapia que en los retardados. Efectos secundarios generalmente poco importantes, siendo relativamente comunes las cefaleas. Todos ellos tienen una eficacia similar, especialmente en quimioterapia moderada o levemente emetogénica, con una mínima incidencia de efectos adversos. La eficacia en el control de los vómitos y náuseas tardíos en la quimioterapia está menos estudiada; es más, no existe una buena base científica para emplear estos fármacos en este tipo de vómitos, puesto que no se ha observado liberación de serotonina en los mismos. De hecho, los pocos estudios clínicos disponibles muestran poco o ningún beneficio por el empleo de estos fármacos frente a placebo. El palonosetrón es el último fármaco incorporado al grupo. Presenta una semivida de eliminación notablemente superior al resto del grupo (40 h, frente a 3-4 para ondansetrón y granisetron). Ha sido autorizado para la prevención de las náuseas y los vómitos agudos asociados con la quimioterapia oncológica altamente o moderadamente emetógena. Es importante la distinción que se hace en la indicación autorizada, en el sentido de que solo se ha aceptado su uso para prevenir las náuseas y vómitos agudos (es decir, durante las primeras 24 horas) inducida por quimioterapia intensamente emetógena (especialmente, los complejos de platino), mientras que se acepta también para la prevención de las náuseas y vómitos inducidos por quimioterapia moderadamente emetógena, tanto de la fase aguda como de la diferida.
CANNABINOIDES Tetrahidrocannabinol Nabilona <i>Desconocido, posiblemente relacionado con acción sobre receptores de opiáceos</i>	Son los constituyentes activos de la marihuana, o derivados de los mismos. Se han usado en vómitos de quimioterapia. Por lo general la potencia es inferior a los anteriormente citados, y la incidencia de efectos secundarios es elevada, especialmente en ancianos. No están comercializados en España. Hay diferencias de respuesta según el agente causal: los vómitos por carmustina responden bien, los del cisplatino o ciclofosfamida bastante peor. Se consideran medicamentos de segunda línea.
CORTICOSTEROIDES Dexametasona, y otros del grupo H02 <i>Desconocido</i>	Tienen una acción antiemética propia frente a vómitos de quimioterapia de intensidad moderada, pero lo más interesante es que la acción es aditiva con la de metoclopramida y ondansetrón (y otros antagonistas de serotonina). En uso intermitente no se manifiestan los efectos secundarios típicos de los corticoides y no parece tampoco que favorezca la evolución tumoral.

MEDICAMENTO MECANISMO DE ACCIÓN	COMENTARIOS
ANTAGONISTAS RECEPTORES DE NEUROKININAS Aprepitant Fosaprepitant <i>Bloqueo selectivo y de alta afinidad de los receptores NK₁ de la sustancia P (neurocinina 1) humana.</i>	El aprepitant es un bloqueante altamente selectivos de los receptores NK ₁ de las neurocininas. No está relacionado química ni farmacológicamente con otros fármacos, antieméticos o de otro tipo. Los receptores NK ₁ están ampliamente distribuidos por todo el organismo, estando implicados a numerosas actividades fisiológicas y patológicas. En relación con las áreas cerebrales implicadas en el control de la emesis, se ha observado la presencia de receptores NK ₁ en el núcleo basal del complejo dorsal vagal. El fármaco inhibe la emesis inducida por agentes quimioterápicos citotóxicos, como el cisplatino, a través de un efecto sobre el sistema nervioso central; en este sentido, el aprepitant es capaz de atravesar la barrera hematoencefálica, ocupando los receptores NK ₁ cerebrales. El aprepitant , asociado a una terapia estándar de corticosteroide y antagonista 5-HT ₃ , es capaz de incrementar la respuesta antiemética en pacientes sometidos a quimioterapia altamente emetógena, como es la basada en el empleo de derivados del platino (cisplatino, especialmente). El efecto antiemético del aprepitant se manifiesta tanto sobre la fase aguda como sobre la fase tardía de la emesis inducida por quimioterapia. El fosaprepitant es un profármaco del aprepitant , que tras su administración intravenosa se transforma rápidamente en el principio activo.
BENZODIAZEPINAS Diazepam Lorazepam y otros de grupo N05B <i>Desconocido</i>	Las benzodiazepinas son poco potentes como antieméticos en uso aislado, pero son útiles como coadyuvantes de otro tratamiento. El lorazepam en especial es bastante utilizado para prevenir el vómito anticipatorio que suele aparecer con la repetición de tratamientos de quimioterapia.

TABLA II. TRATAMIENTO SEGUN TIPO DE VÓMITO

NATURALEZA DEL VOMITO	MEDICACION APROPIADA	OBSERVACIONES
Mareo cinético	Escopolamina Cinarizina ANTIISTAMINICOS: Dimenhidrinato Meclozina, etc.	La escopolamina es más efectiva que los antihistamínicos, aunque la incidencia de efectos secundarios (de tipo anticolinérgico, sobre todo sequedad de boca) es algo superior. La meclozina tiene una duración de acción de 24 horas. El resto necesitan entre 2 y 4 tomas al día, pero son más apropiados para viajes cortos. Los comprimidos comercializados de cinarizina (75 mg) no son apropiados para uso en mareo cinético (dosis de 30 mg 1/2 hora antes de iniciar el viaje, 15 mg cada 8 horas después). Usar la presentación en gotas.
Embarazo.	ANTIISTAMINICOS: Prometazina Doxilamina FENOTIAZINAS: Tietilperazina	A pesar de la controversia pública sobre efectos teratogénicos del MERBENTAL , el consenso general es que la asociación doxilamina/piridoxina no ha mostrado ser nociva para el feto. También se consideran seguros los dos fármacos que se citan en la columna precedente. De cualquier forma, el tratamiento farmacológico de los vómitos del embarazo debe reservarse a casos donde resulte imprescindible.
Vómitos postoperatorios.	ORTOPRAMIDAS FENOTIAZINAS ANTISEROTONÉRGICOS	Las ortopramidas no deben ser usadas tras cirugía gastrointestinal o en presencia de obstrucción intestinal.
Migraña.	Metoclopramida	La metoclopramida alivia además la estasis gástrica y permite la mejor absorción de otros medicamentos antimigrañosos.
Vómitos inducidos por medicamentos.	FENOTIAZINAS	
Enfermedades hepatobiliares.	ORTOPRAMIDAS: Metoclopramida	
Gastroenteritis viral aguda	FENOTIAZINAS	En general no precisan más tratamiento que reposición de líquidos y electrolitos. Las bebidas a base de cola pueden aliviar la sintomatología. Evaluar sobre todo los problemas de prescribir fenotiazinas a niños.
Síndrome de Meniere, laberintitis, etc.	Betahistina Cinarizina	Pueden servir también los medicamentos indicados en mareos cinéticos, así como las fenotiazinas. En general son cuadros de difícil tratamiento.
Radioterapia. Quimioterapia.	Todos	Ningún medicamento es totalmente satisfactorio, por lo que es frecuente recurrir a combinaciones entre dos o más de ellos, aunque la dexametasona (u otro corticosteroide potente) parece ser un requerimiento más o menos fijo.

Conclusion

Los antieméticos de acción periférica son medicamentos que se utilizan para prevenir y tratar las náuseas y los vómitos actuando fuera del sistema nervioso central, generalmente en el tracto gastrointestinal o en el área de los quimiorreceptores periféricos. A diferencia de los antieméticos de acción central, estos medicamentos no cruzan la barrera hematoencefálica, lo que minimiza los efectos secundarios como la sedación y los trastornos neurológicos.

Algunos de los antieméticos de acción periférica más comunes incluyen:

1. ***Domperidona***: Bloquea los receptores de dopamina (D2) en la zona quimiorreceptora del sistema digestivo. Es eficaz en el tratamiento de las náuseas y los vómitos asociados con diversas condiciones gastrointestinales y migrañas.
2. ***Metoclopramida***: Aunque tiene acción central, su efecto periférico al aumentar la motilidad gastrointestinal y acelerar el vaciamiento gástrico lo hace útil en la prevención de náuseas y vómitos, especialmente postoperatorios y por quimioterapia.
3. ***Antiácidos y protectores gástricos***: Algunos medicamentos que neutralizan el ácido gástrico o protegen la mucosa gástrica, como el sucralfato o los inhibidores de la bomba de protones (omeprazol), pueden indirectamente reducir las náuseas y los vómitos al tratar la irritación gástrica y el reflujo ácido.
4. ***Análogos de la somatostatina (octreotida)***: Usados en condiciones específicas como la obstrucción intestinal, reducen la secreción gastrointestinal y la motilidad, ayudando a controlar los síntomas de vómitos.

Estos medicamentos son elegidos según la causa subyacente de las náuseas y los vómitos, y su perfil de efectos secundarios. La domperidona, por ejemplo, es preferida en casos donde se desea evitar los efectos centrales de otros antieméticos.

<https://www.cancer.gov/espanol/cancer/tratamiento/efectos-secundarios/nauseas/nauseas-pro-pdq>