



Mi Universidad

Antieméticos De Acción Central

Bryan Reyes González

Antieméticos De Acción Central

Tercer Parcial

Medicina Paliativa

Dr. Agenor Abarca Espinoza

Licenciatura En Medicina Humana

6to Semestre Grupo "C"

INTRODUCCION

Para entender los fármacos antieméticos de acción central se debe comprender los siguientes puntos en el cual nos ayudará a comprender la utilización de estos fármacos para un tipo de paciente por ejemplo pacientes con náuseas y vómitos.

Las náuseas y vómito pueden ser manifestaciones de una amplia gama de trastornos, entre ellos, efectos adversos de fármacos, trastornos generales o infecciones, embarazo, disfunción vestibular, infecciones del sistema nervioso central o hipertensión intracraneal, peritonitis, trastornos epatobiliares, radiación o quimioterapia y obstrucción gastrointestinal, trastornos de la motilidad o infección.

Comprendiendo esto debemos saber como es la fisiopatología para estudiar las alteraciones de las distintas funciones del cuerpo humano para comprender el porqué de la aparición de diversas enfermedades, en este caso los síntomas como el vómito y náuseas.

Una vez comprendiendo la fisiopatología ahora si ya se entraría a lo que viene siendo la utilización de los fármacos en los síntomas de náuseas y vómitos, como en este caso sería los:

- Antagonistas DA, Metoclopramida.
- Antagonistas 5-HT₃, Ondasetrón.
- Canabinoides, Nabilona.
- Corticoides, Dexametasona.

Conociendo estos fármacos nos ayudarán a controlar o prevenir las náuseas y vómitos producidos por varios factores mencionados anteriormente.

Más adelante mencionare en conjunto y completo de lo que se debe conocer para el tratamiento de estos síntomas de náuseas y vómitos para poder conocer y saber como hacer un buen tratamiento para estos pacientes con los síntomas mencionados.

RESUMEN

Como se menciona en la introducción su **fisiopatología** de los síntomas de vómitos y náuseas.

El “centro del vómito en el tronco encefálico es una región neuronal vagamente organizada dentro de la formación reticular ubicada en la porción lateral del tronco del cerebro, que coordina el acto complejo del vómito a través de las interacciones con los pares craneales VIII y X y las redes neurales en el núcleo del haz solitario que controla los centros respiratorio, salival y vasomotor. Se han identificado en el centro del vómito elevadas concentraciones de los receptores M, muscarínicos, H₁ de la histamina, de la neurocinina 1 (NK₁) y 5-HT, de la serotonina.

1. La “zona emetógena de quimiorreceptores” o área postrema está localizada en el extremo caudal del cuarto ventrículo. Ésta se encuentra fuera de la barrera hematoencefálica pero esta accesible a los estímulos emetógenos provenientes de la circulación sanguínea o del líquido cefalorraquídeo. En la zona emetógena de quimiorreceptores abundan los receptores D₂ para dopamina y los receptores de opioides, y posiblemente los receptores 5-HT, de serotonina y los receptores NK₁.
2. El sistema vestibular es importante en la cinetosis a través del VIII par craneal. Tiene abundantes receptores M₁ para la histamina.
3. Los nervios aferentes vagales y medulares del tubo digestivo son ricos en receptores 5-HT₃. La irritación de la mucosa del tubo digestivo por quimioterapia, radioterapia, distensión o gastroenteritis infecciosa aguda desencadena la liberación de serotonina de la mucosa y la activación de estos receptores, los cuales estimulan los impulsos aferentes vagales al centro del vómito y la zona emetógena de quimiorreceptores.
4. El sistema nervioso central interviene en el vómito por trastornos psiquiátricos, estrés y el vómito anticipatorio previo a la quimioterapia de cáncer.

La identificación de los diferentes neurotransmisores que participan en el vómito ha permitido desarrollar un grupo de diversos fármacos antieméticos que tienen afinidad por diversos receptores. A menudo se utilizan combinaciones de fármacos antieméticos con diferentes mecanismos de acción, sobre todo en los pacientes con vómito consecutivo a fármacos quimiorreceptores.

Ahora que ya sabemos de la fisiopatología, ahora entraremos en el tema de los fármacos y con el que empezaremos con el de Antagonistas de los receptores:

5-HT₃ de la serotonina.

Farmacocinética y farmacodinámica.

Los antagonistas selectivos de los receptores 5-HT₃ tienen potentes propiedades antieméticas que son mediadas en parte por el bloqueo central del receptor 5-HT₃ en el centro del vómito y la zona emetógena de quimiorreceptores pero principalmente a través del bloqueo de los receptores 5-HT₃ periféricos o los nervios vagales intestinales extrínsecos y los aferentes medulares. La acción antiemética de estos fármacos está limitada al vómito atribuible a la estimulación vagal por ejemplo (posoperatorio) y la quimioterapia; no se controlan bien otros estímulos eméticos como la cinetosis.

Se dispone de 4 fármacos de este tipo en Estados Unidos: **ondansetrón**, **ganisetrón**, **dolasetrón** y **palonosetrón**.

Los primeros tres fármacos tienen una semivida sérica de cuatro a nueve horas y pueden administrarse una vez al día por vía oral o intravenosa.

El **palonosetrón** es un fármaco intravenoso más nuevo que tiene una afinidad por el receptor 5-HT₃ y una semivida sérica prolongada de 40 horas.

Los cuatro fármacos experimentan un metabolismo hepático considerable y son eliminados por excreción renal y hepática. No es necesario reducir la dosis en pacientes geriátricos o en los que presentan insuficiencia renal.

Benzamidas sustituidas.

Las benzamidas sustituidas son la **metoclopramida** y la **trimetobenzamida**. Se considera que su principal mecanismo de acción antiemética es el bloqueo del receptor de dopamina. La **trimetobenzamida** también tiene una actividad antihistamínica débil. Para prevenir y tratar náuseas y vómitos, se puede administrar **metoclopramida** en la dosis relativamente elevada de 10 a 20 mg por vía oral o vía intravenosa cada seis horas. La dosis usual de **trimetobenzamida** es 300 mg por vía oral o 200 mg en inyección intramuscular. Los principales efectos adversos de estos antagonistas centrales de la dopamina son extrapiramidales: inquietud, distonía y síntomas parkinsonianos.

Canabinoides.

El **dronabinol** (THC), el principal principio psicoactivo de la marihuana.

La nabilona es un analogo del THC muy relacionado que se ha estado comercializando en otros paises y que en la actualidad está autorizado para utilizarse en Estados Unidos.

Corticoides.

Los corticoides (**dexametasona**) tiene propiedades antieméticas, pero se desconoce la causa de estos efectos.

Este compuestos al parecer aumentan la eficacia de los antagonistas del receptor 5-HT₃ para prevenir náuseas y vómitos agudos y tardios en los pacientes que reciben esquemas de quimioterapia moderada o intensamente emetógenos. Aunque se han utilizado diversos corticoesteroides, suelen administrarse 8 a 20 mg por via intravenosa antes de la quimioterapia, seguidos de 8mg/día por via oral durante dos a cuatro dias.

CONCLUSIÓN.

Los antieméticos de acción central son medicamentos utilizados para prevenir y tratar las náuseas y los vómitos, actuando directamente sobre el sistema nervioso central. Estos fármacos suelen funcionar al bloquear los receptores en el cerebro responsables de desencadenar estos síntomas. Algunos de los principales tipos de antieméticos de acción central incluyen:

- **Antagonistas de los receptores de serotonina (5-HT₃):** Como el ondansetrón y el granisetron, son eficaces en la prevención de náuseas y vómitos inducidos por la quimioterapia, la radioterapia y la cirugía.
- **Antagonistas de los receptores de dopamina (D₂):** Ejemplos incluyen metoclopramida y proclorperazina, utilizados para tratar náuseas y vómitos de diversas causas, incluidas las migrañas y los trastornos gastrointestinales.
- **Canabinoides:** Cannabis y los cannabinoides se han estudiado para aliviar el dolor, las náuseas y los vómitos, así como la ansiedad y la pérdida del apetito causados por el cáncer o los efectos secundarios de los tratamientos del cáncer.
- **Corticoides:** Los corticoides tienen un elevado índice terapéutico y son eficaces como tratamiento único en los vómitos agudos. Además, resultan particularmente útiles en combinación con los antagonistas del receptor 5-HT₃ o del receptor de la dopamina. Los cannabinoides también tienen un índice terapéutico bajo.

En conclusión, los antieméticos de acción central son herramientas cruciales en el manejo de las náuseas y los vómitos, especialmente en contextos clínicos como la quimioterapia, la cirugía y otras afecciones médicas. Su uso adecuado mejora significativamente la calidad de vida de los pacientes al controlar síntomas debilitantes. La elección del antiemético específico depende de la causa subyacente de las náuseas y vómitos, así como de las características individuales del paciente.

BIBLIOGRAFIA:

FARMACOLOGÍA BÁSICA Y CLÍNICA. KATZUNG BERTRAM. 13va Ed. LANGE