

Actividad de plataforma

Docente : Doc . Amador Javalois Daniel

Terapeutica Farmacologica

Alumno, Fredy cesar peña Lopez

Licenciatura en medicina humana

Cuarto semestre

Grupo A

Universidad del sureste

ANTIDEPRESIVOS

ANTIDEPRESIVOS, HETEROCICLICOS (TRICICLICOS Y TETRACICLICOS)

Son inhibidores de la recaptación de neurotransmisores y algunos son capaces de bloquear temporalmente el ingreso de noradrenalina a neuronas noradrenergicas, bloquean también receptores colinérgicos, muscarínicos, histamínicos alfa 1 y 2 adrenergicos y dopaminérgicos, los medicamentos son, amitriptilina, imipramina, nortriptilina, desimipramina, clomipramina, amoxapina y otros.

AMITRIPTILINA

Es una amina terciaria y su mecanismo de acción predominantemente, es la inhibición de la recaptación de serotonina y noradrenalina en las terminaciones nerviosas, aumentando su acción postsináptica.

REACCIONES ADVERSAS

Estreñimiento, retención urinaria, sequedad de boca, somnolencia, sedación, aumento de peso, alucinaciones, nerviosismo e impotencia sexual.

CONTRA INDICACIONES

No en enfermos con glaucoma, hipertrofia prostática, alcoholismo e hipersensibilidad.

IMIPRAMINA

Más estudiado en tratamiento de crónico de la depresión recurrente, bloquea la recaptación de noradrenalina y serotonina.

REACCIONES ADVERSAS

Incluye boca seca, náuseas, vómito, anorexia, temblor, cefalea, somnolencia, fatiga, visión borrosa e hipotensión.

CONTRA INDICACIONES

Insuficiencia hepática, renal, glaucoma e hipersensibilidad.

ISRS

El objetivo era la selección prioritaria, para que actuaran de manera selectiva a canales iónicos, receptores o enzimas, para promover pocos efectos secundarios. Dentro de estos encontramos, fluoxetina, paroxetina, sertralina, citalopram, escitalopram, etc.

FLUOXETINA

Inhibe la recaptación de serotonina en las terminaciones nerviosas.

REACCIONES ADVERSAS

Disfunción sexual como efecto predominantemente en un 40 % de los pacientes, además de cefalea, nerviosismo, insomnio, somnolencia, fatiga, alteraciones gastrointestinales, náuseas, diarrea, boca seca.

CONTRA INDICACIONES

Contraindicado en hipersensibilidad al compuesto.

PAROXETINA

El objetivo era la selección prioritaria, para que actuaran de manera selectiva a canales iónicos, receptores o enzimas, para promover pocos efectos secundarios. Dentro de estos encontramos, fluoxetina, paroxetina, sertralina, citalopram, escitalopram, etc.

REACCIONES ADVERSAS

El objetivo era la selección prioritaria, para que actuaran de manera selectiva a canales iónicos, receptores o enzimas, para promover pocos efectos secundarios. Dentro de estos encontramos, fluoxetina, paroxetina, sertralina, citalopram, escitalopram, etc.

CONTRA INDICACIONES

El objetivo era la selección prioritaria, para que actuaran de manera selectiva a canales iónicos, receptores o enzimas, para promover pocos efectos secundarios. Dentro de estos encontramos, fluoxetina, paroxetina, sertralina, citalopram, escitalopram, etc.

IRSN

Actúan sobre principales mecanismos de acción y contribuyen al aumento de concentración de neurotransmisores en la biofase, lo que a largo plazo se relaciona con el efecto antidepresivo. Grupo formado por venlafaxina, milnacipram, duloxetina, tomoxetina, etc.

VENLAFAXINA

Potente inhibidores de la recaptación de serotonina y noradrenalina aunque aumenta su eficacia es en un 5.3 veces más serotonina.

REACCIONES ADVERSAS

Náuseas en un 25 % de los casos, somnolencia en un 24 % sequedad bucal en dosis medias y baja.

CONTRA INDICACIONES

Hipersensibilidad

MILNACIPRAM

Inhibe recaptación de serotonina y noradrenalina, no presenta afinidad a receptores muscarínicos, histamínicos, dopaminérgicos, opioides o canales iónicos.

REACCIONES ADVERSAS

Náuseas en un 25 % de los casos, somnolencia en un 24 % sequedad bucal en dosis medias y baja.

CONTRA INDICACIONES

Hipersensibilidad

ANSIOLITICOS

BENZODIAZEPINAS

Propiedades:
ansiolíticas ,
hipnoticas
anticonvulsivas
miorrelajantes.

ACCIÓN PROLONGADA

Vida media de 24 hr o mas la biotransformacion de estos compuestos da lugar a metabolitos activos . Un ejemplo de estos farmacos son , clonazepam , clobazepam , clorazepato. y diazepam.

ACCIÓN INTERMEDIA

Vida media de 5 a 24 hr , biotransformacion no da lugar a metabolitos activos, estos farmacos son ,alprazolam , lorazepam , bromazepam y temazepam .

ACCIÓN CORTA

Vida media menor a 5 hr y no hay presencia de metabolitos activos, como ejemplo, triazolam , midazolam y oxacepam .

FARMACODINAMIA

Favorece la transmisión gabaérgica e inhibe el recambio de ciertos neurotransmisores como noradrenalina , serotonina , acetilcolina y dopamina , aumenta actividad de receptores de BZD , junto al complejo iónico GABA , permitiendo que el ion fluya al interior de la membrana inhibiendo la excitación neuronal , también aumenta la concentración de Ca^{+2} interneuronal dependiendo de K^{+} .

REACCIONES ADVERSAS

Sedación ,somnolencia, Disminución de la atención, disminución de la agudeza mental y de la coordinación muscular, se le agrega reacciones inespecificas como reacciones alergicas , cutaneas , oligomenorrea y alteraciones de la función sexual .

CONTRAINDICACIONES

Contraindicado en caso de hipersensibilidad, insuficiencia cardiaca , hepatica o renal grave.

NO BZD

Carecen de acción hipnoticas ,anticonvulsivas y miorrelajantes , no altera la memoria y mas que sedición produce insomnio ,los que pertenecen a este grupo son buspirona , gepirona , isapirona y tandospirona

BUSPIRONA

Afinidad a los receptores dopaminérgicos D_1 , actúa como agonista de receptores 5-HT $1A$ somatodentríticos en las neuronas serotoninérgicas del rafe medio, disminuye la tasa de disparo espontanea , disminuyendo el metabolismo de serotonina en el núcleo estriado , hipocampo y septum .

REACCIONES ADVERSAS

Mas frecuentes , marea , nauseas , cefalea , nerviosismo , insomnio, fatiga , excitación y sudación .

CONTRAINDICACIONES

En hipersensibilidad, insuficiencia hepatica o renal grave

ZOLPIDEM

Actúa a nivel de receptores omega , se une de forma selectiva al receptor omega 1 facilitando la inhibición neuronal mediada por GABA ,

REACCIONES ADVERSAS

Cefalea, somnolencia como efecto predominantemente, mareo , nauseas, vomitos y mialgias , a dosis mayores causa depresión respiratoria .

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad, insuficiencia respiratoria , hepatica, síndrome de apnea del sueño y menores de 15 años de edad

Antipsicóticos

Mecanismos de acción

El perfil farmacológico de los antipsicóticos se centrará en el antagonismo de los receptores dopaminérgicos D₂, e incluso se postuló un mecanismo particular para la clozapina, el bloqueo de los receptores dopaminérgicos del subtipo D₄.

Posteriormente sincrementó el interés por el papel de la serotonina, apareciendo los antagonistas mixtos de los receptores 5-HT₂/D₂.

Pero actualmente la neurobiología de la esquizofrenia se centra en la existencia de una alteración de la comunicación cortical y de la integración corticomesencefálica, con la participación de múltiples neurotransmisores.

La mayor parte de estos fármacos, como el haloperidol, la perfenazina o la tioridazina, son metabolizados por el citocromo P-450 CYP2D6, y otros los son por el P-450 CYP3A4.

Farmacocinética

Aunque con importantes diferencias entre ellos, todos los antipsicóticos clásicos, típicos o tradicionales tienen una absorción muy aceptable tanto por vía oral como por vía parenteral.

Metabolismo

El metabolismo suele ser hepático y ocurre a través de la conjugación con ácido glucurónico, hidroxilación, oxidación, desmetilación y formación de sulfóxidos.

Eliminación

La semivida de eliminación suele oscilar para muchos antipsicóticos entre 10 y 30 horas.

Sin embargo, esta eliminación es parcial, porque, debido a su alta liposolubilidad, gran cantidad se acumula en tejidos como grasa, pulmón o cerebro.

En este sentido, hay que tener en cuenta que la actividad biológica de un antipsicótico puede prolongarse más tiempo del predecible a partir de su semivida.

Clasificación

Antipsicóticos atípicos

- Antagonistas 5-HT₂/D₂: clozapina, olanzapina, risperidona, sertindol, ziprasidona
- Agonistas parciales: aripiprazol
- Antagonistas D₂/D₃: amisulprida

Indicaciones

Usados en psicosis, manías, alucinaciones, delirios, trastornos psicosepresivos, etc.

Reacciones adversas

Los antipsicóticos clásicos se caracterizan por producir síntomas extrapiramidales e incrementos de prolactina, con consecuencias clínicas importantes debido al bloqueo de los receptores dopaminérgicos D₂ en las vías nigroestriada y tuberoinfundibular.

Antipsicóticos típicos

- Fenotiazinas - Derivados alifáticos: clorpromazina, levomepromazina
- Derivados piperidínicos: tioridazina

- palmitato de pipotiazina (preparado de liberación prolongada) - Derivados piperacínicos: flufenazina decanoato [preparado de liberación prolongada], perfenazina, trifluoperazina

- Tioxantenos: zuclopentixol, zuclopentixol decanoato y acetato [preparado de liberación prolongada]

- Butirofenonas: haloperidol y haloperidol decanoato [preparado de liberación prolongada]

- Difenilbutilpiperidinas: pimozida

- Dibenzoxazepinas: loxapina

- Dibenzotiepina: clotiapina

- Benzamidas: sulpirida, tiaprida

- Función menstrual: - Anovulación, - Amenorrea, - Menstruación irregular e impredecible.

- Función sexual: - Disminución de la libido, - Disminución del orgasmo o anorgasmo, - Impotencia.

- Mamas: - Ginecomastia, - Galactorrea.

- Huesos: disminución de la densidad ósea por deficiencia estrogénica.

- Sistema cardiovascular: - Ateroesclerosis.

- Comportamiento: hostilidad y ansiedad por acción directa y secundaria a hipogonadismo, risperidona es la que tiene un perfil más parecido al haloperidol.

Anestésicos locales

Farmacos usados en la analgesia, su calidad presenta perdida de completa de todas las modalidades sensoriales , se aplican directo al tejido u organo

Mecanismos de accion

Su principal mecanismo es el bloqueo de canales de sodio dependientes de voltaje

Los anestésicos locales actuan en la membrana celular para evitar la generación y conducción de impulsos nerviosos ,bloqueando la conduccion nerviosa

En general la interacción directa ocurre al bloquear la entrada de Na dependientes de voltaje, el umbral de excitabilidad aumenta gradualmente,

la taza de potencial de acción disminuye y la conducción de impulsos nerviosos desacelera , reduciendo asi la la propagacion de potencial de acción y la conducción nerviosa finalmente falla.

Farmacocinetica

Absorción

La absorción se ve mediada por factores varios , tales como

- flujo sanguíneo local
- Dosis
- sitio de administración
- Gravedad
- propiedades fisicoquímicas del farmaco

Metabolismo y excreción

Metabolismo hepatico , dividido en ionizados y no ionizados
Los del grupo amida se metabolizan en el higado ,mientras que los ester lo asen en la circulación mediante la butirilcolinesterasa

La excreción es a nivel renal en los dos grupos , los no ionizados se ionizan por acidificación mediante la orina para que estos se puedan difundir y ser eliminados

Distribución, Se divide en local y sistémica

Local, factor mediado en zona local de organismo, patrón de distribución variado por posición del paciente y gravedad

sistémica . Mediada por flujo sanguíneo máximo , subdividido en distribución rápida y lenta

Toxicidad y efectos adversos

El grupo amida tiene efectos toxicos a nivel hepático en IC hau disminución del metabolismo por la disminución de flujo sanguíneo

Otroos efectos mas comunes a nivel general son nauseas, vomitos , parestesias , reacciones de hipersensibilidad, reacciones vasovagales y simpaticomimeticas

Clasificacion

La principal clasificación esta mediada por su estructura química dividida en esters y amidas

Dentro de los farmacos podemos encontrar en tipo ester ,

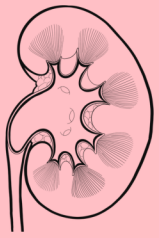
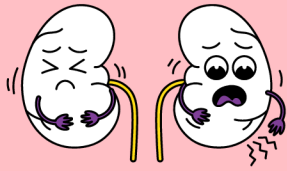
Cloroprocaína,
Procaína, Tetracaína,
Benzocaína, Cocaína,
Butacaína, Pepirocaína

Los de tipo amida son.
Lidocaína,
Bupivacaína,
Mepivacaína,
Ropivacaína,
Levobupivacaína,
Articaína, Etidocaína,
Prilocaína.

Indicaciones,
La amplia gama de anestésicos locales es inespecifica ablando de sus indicaciones generales,aunque son usados para la analgesia en general pero de foma superficial encontramos farmacos en analgesia de tejidos y en su via de administración

- inyectables
- para analgesia de mucosas y piel
- de baja solubilidad acuosas
- oftálmico
- Tópico
- Infiltración

Glucocorticoides



Mecanismo de acción

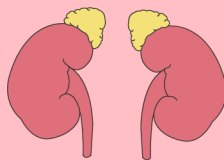
Los esteroides suprarrenales actúan mediante su interacción con receptores intracelulares o con receptores presentes en la membrana celular, la unión de los corticosteroides con factores de transcripción (receptores intracelulares conocidos genéricamente como receptores nucleares) de la familia de las hormonas esteroideas, tiroideas y de la vitamina D.

promueve la transcripción génica, generalmente mediante mecanismos de unión a secuencias reguladoras.

Receptores

Los receptores de glucocorticoides en su estado inactivo están asociados a un complejo proteico constituido por varias chaperonas.

Como son las proteínas de choque térmico (heat shock protein; HSP 90, HSP70 y HSP 56) y una inmunofilina.



Farmacocinética

Las vías de administración de los corticosteroides son: oral, intramuscular, intravenosa, inhalatoria o tópica.

La elección de la vía de administración que se utilizará dependerá de la necesidad de obtener un efecto con una duración y una potencia determinadas.

La absorción por vía oral de los corticosteroides naturales es en general buena, y la de los sintéticos depende de su estructura, aunque en general también se considera aceptable.

Metabolismo

El metabolismo de los corticosteroides se lleva a cabo en el hígado, donde sufren una serie de cambios metabólicos que impiden la unión a sus receptores, aumentando su solubilidad en agua y facilitando por lo tanto su excreción en la orina.

Distribución

El transporte de los corticosteroides se lleva a cabo por proteínas plasmáticas, en condiciones fisiológicas, el 90 % del cortisol plasmático se encuentra unido a proteínas, mientras que el 10 % restante circula libremente, pudiendo activar los receptores celulares.

Eliminación

La eliminación de los corticosteroides se lleva a cabo mayoritariamente por vía urinaria (90 %) y, de forma minoritaria, por el aparato gastrointestinal (10 %).

Clasificación

Efecto terapéutico »»

Corta: Duración de 6-12 horas, como la hidrocortisona.

Intermedia: Duración de 12-36 horas, como la prednisona, metilprednisona, triamcinolona, y deflazacort.

Prolongada: Duración de 36-72 horas, como la dexametasona y betametasona.

Indicaciones Terapéuticas

En la actualidad, los fármacos con acción glucocorticoide se emplean en numerosas enfermedades, principalmente como antiinflamatorios e inmunosupresores, aunque poseen una gran eficacia, es importante mencionar que presentan efectos secundarios que deben tenerse en cuenta a la hora de la prescripción médica y, por lo tanto, en muchos casos hay que sospechar de forma cuidadosa el beneficio-riesgo del tratamiento con estos fármacos.

Puede usarse en »»

- Asma
- EPOC
- Insuficiencia suprarrenal
- Enfermedades Autoinmunitarias
- Enfermedades hematológicas
- Enfermedades cutáneas, oftalmológicas etc.

Efectos adversos

Efectos metabólicos

- Aumento de la síntesis hepática de glucógeno y glucosa.
- Disminución del metabolismo de glucosa en numerosos tejidos.
- Movilización de ácidos grasos y proteínas.

Efectos cardiovasculares y renales

- Retención de sodio y agua (aldosterona). aumento del retorno venoso.
- Los glucocorticoides aumentan la tasa de filtración glomerular y el flujo renal.
- Aumentan la excreción renal de calcio. - Resultado: hipertensión arterial.

Sistema nervioso

- En tratamiento de sustitución, mejora del estado de ánimo.
- Cambios conductuales, euforia, insomnio.

Músculo y hueso - Pérdida de masa muscular y ósea

Otras hormonas - Interfieren en la secreción de GH en niños

Inflamación e inmunidad - Suprimen la mayoría de los componentes de la inflamación. - Inmunosupresión

Miorrelajantes

Mecanismo de acción

Periférico

Los relajantes musculares periféricos, también conocidos como bloqueadores neuromusculares, actúan directamente en la unión neuromuscular, la zona donde las neuronas se conectan con los músculos. Estos fármacos pueden:

- Bloquear la liberación de acetilcolina

- Compete con la acetilcolina en los receptores: Impidiendo que la acetilcolina se una y active los receptores en la placa motora.

- Despolarizar la placa motora: Causando una contracción inicial seguida de una parálisis.

- Interferir con la entrada de calcio a nivel presináptico: Reduciendo la liberación de acetilcolina.

Central

Los relajantes musculares de acción central actúan en el sistema nervioso central (SNC) para reducir la actividad de las neuronas que controlan la contracción muscular.

Algunos pueden inhibir las neuronas motrices en la médula espinal, mientras que otros pueden actuar en áreas más altas del cerebro, como el tronco encefálico, para modular la información que llega a las neuronas motrices.

Indicaciones

Esclerosis múltiple, Rigidez matinal, lesiones, dolor, contracturas, cirugías etc

Farmacos mas reconocidos

La amplia variedad de miorrelajantes, se relaciona no solo a fármacos específicos de este grupo si no también otros fármacos que interactúan en el SN

Baclofeno.》》

se caracteriza por reducir la actividad de la neurona motora gamma, se emplea para reducir la frecuencia de espasmos flexores y extensores.

Puede tener contraindicaciones para los pacientes renales, cuya dosis siempre será menor.

Tizanidina.》》

se suele emplear para el tratamiento de la espasticidad de diversas patologías, es menos sedativa que otros relajantes musculares y no reduce la presión arterial de forma notable.

Puede ser agresivo para pacientes hepáticos, ya que se metaboliza, principalmente, en el hígado.

Diazepam.》》

se emplea en el tratamiento de la ansiedad, ya que produce relajación muscular y somnolencia.

Este fármaco ejerce sus acciones, directamente, en el sistema nervioso. Se emplea en el tratamiento de enfermedades como la esclerosis múltiple, ya que alivia los espasmos musculares dolorosos, y preserva la movilidad

Ciclobenzaprina.》》

tiene una particularidad, ya que actúa sobre el tronco encefálico, en vez de sobre la médula espinal.

Está relacionado con los antidepresivos, por lo que, está contraindicado para pacientes cardíacos.

Reacciones adversas

Entre los efectos secundarios más habituales se encuentran》》

la somnolencia, mareos, náuseas, vómitos, sequedad de boca y fatiga.

También pueden aparecer otros efectos como debilidad muscular, visión borrosa, dolor de cabeza y alteraciones en el ritmo cardíaco.

En casos raros, pueden producir reacciones más graves como alucinaciones, erupciones cutáneas o dificultad para respirar

Clasificación

Bloqueadores Neuromusculares:

Succinilcolina, atracurio, vecuronio, rocuronio.

Espasmolíticos:

Baclofeno, tizanidina, diazepam, carisoprodol, metocarbamol.

Bibliografía

**Farmacologia del Doctor
Pierre ,pdf**

**Velazquez Farmacologia
Basica y clinica 19° Edición.**