

FÁRMACOS COLINÉRGICOS

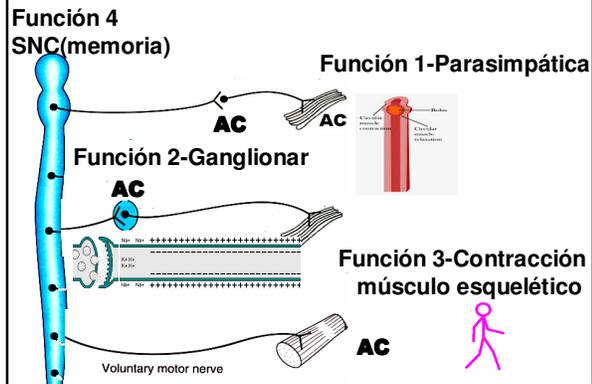
M.E. Quintanilla - Medicina 2011
Programa de Farmacología
Molecular y Clínica - ICBM

COLINÉRGICOS ACTÚAN EN EL SISTEMA NERVIOSO AUTÓNOMO O NEUROVEGETATIVO

SNA: Regula funciones que se producen sin control de la conciencia

- ☞ Contractilidad cardiaca
- ☞ Contracción músculo liso gastrointestinal
- ☞ Contracción músculo liso bronquial
- ☞ Contracción músculo liso vesical y ureteres

Acetilcolina tiene 4 funciones diferentes

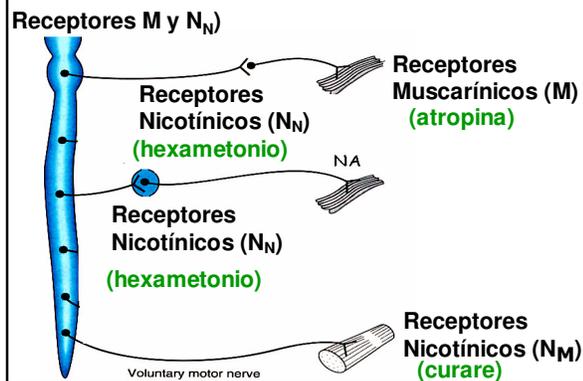


Fármacos Colinérgicos

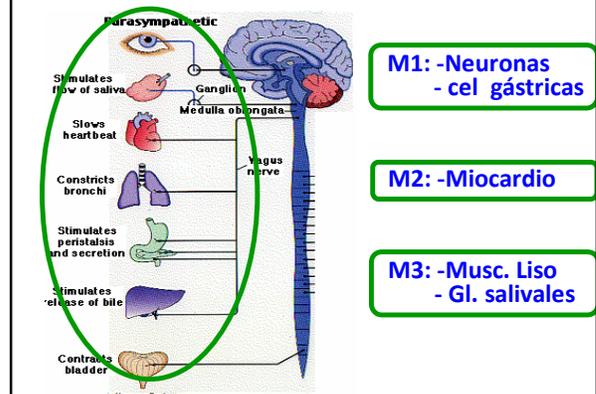
Son aquellos que imitan la función de la acetilcolina liberada por las fibras post-ganglionares parasimpáticas (Función - 1)

- ☞ Colinérgicos imitan función del parasimpático

Tipos de receptores colinérgicos



Localización de Receptores Muscarínicos

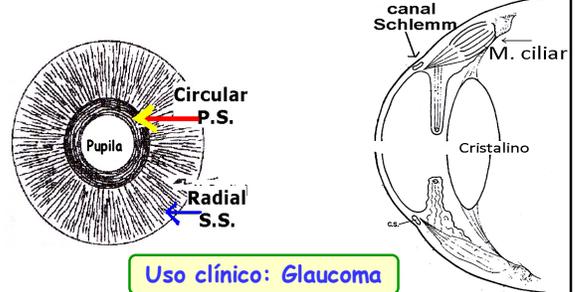


Acciones Farmacológicas de los Colinérgicos

o
Acciones muscarínicas de acetilcolina

1. OJO

- 1.- Miosis (contraen músculo circular)
- 2.- Acomodan cristalino para visión cercana (contraen ciliar)
- 3.- ↓ Presión Ocular por la acción en músculos circular y ciliar



2.- Sistema Cardiovascular

👉 Vasodilatación (receptores M3 endotelio)

2. Corazón

👉 Bradicardia

👉 ↓ Contractilidad

👉 ↓ Conducción A-V

3.- Bronquio

👉 Broncoconstricción

👉 ↓ secreciones bronquiales

Contraindicados en el asma

4.- Aparato Digestivo

👉 ↑ tono y peristaltismo estómago e intestino

Uso clínico: Ileo paralítico post-operatorio

👉 Estimulan secreción gástrica

Contraindicados en la úlcera péptica

5.- Sistema urinario

👉 Contraen el músculo detrusor de la vejiga

👉 Relajan el esfínter vesical

Uso clínico: Atonia vesical post-operatoria

6.- Glándulas exocrinas

- Estimulan secreción salival
- Estimulan secreción lagrimal
- Estimulan sudoración

Usos clínicos de los colinérgicos

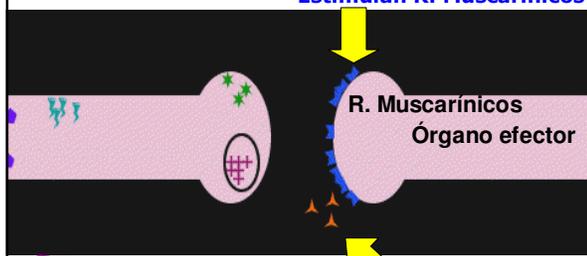
- Galucoma agudo o crónico
- Ileo paralítico post-operatorio (siempre que no haya obstrucción)
- Retención urinaria post-operatoria

Contraindicaciones de los colinérgicos

- Asma bronquial
- Úlcera péptica

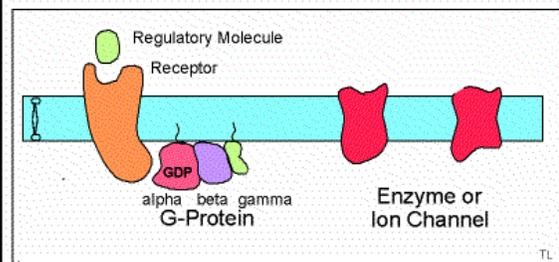
Clasificación de los colinérgicos

1.- Colinérgicos Directos Estimulan R. Muscarínicos



2.- Colinérgicos Indirectos Inhiben la enzima Acetilcolinesterasa (AChE)

1.- Colinérgicos Directos



Acciones farmacológicas: actúan en todos los órganos inervados por parasimpático imitando las acciones muscarínicas de acetilcolina

Clasificación Colinérgicos Directos

1.- NATURALES

PILOCARPINA

Uso clínico de pilocarpina
Glaucoma agudo

MUSCARINA

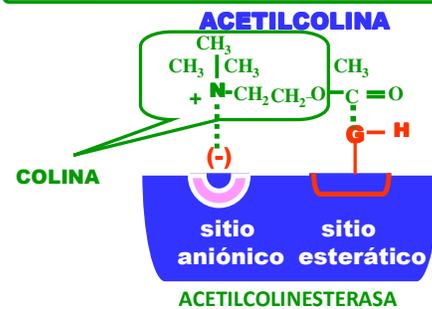


Amanita Muscaria

2.- SINTÉTICOS

CARBACOL

Colinérgicos Indirectos: Inhibición de la acetilcolinesterasa



Colinérgicos Indirectos:
Compiten con acetilcolina por sitios aniónico y esterático de la enzima y son hidrolisados muy lentamente

Clasificación Colinérgicos Indirectos

1.-Reversibles (Inhiben AChE 4-6 horas)

Neostigmina Fisostigmina

2.-Irreversibles(organofosforados) **Son tóxicos**

(Inhiben AChE durante cientos de horas)

Gas sarín, somán etc. Empleados como armas guerra

Malation, palation etc. Empleados como insecticidas

1.-Reversibles (ocupan sitio aniónico y esterático)

Neostigmina (N+ cuaternario) no pasa BHE

Usos clínicos: 1.-Miastenia gravis
2.-Ileo paralítico
3.-Atonia vesical

Fisostigmina (N terciario) pasa BHE

Uso clínico: Intoxicación Atropínica

2.-Irreversibles (ocupan sitio esterático)

Compuestos Organofosforados: Toxicología

- ➔ Unión covalente a la enzima.
- ➔ Unión se hace irreversible "envejecimiento"
- ➔ Gran acumulación de Ach en todas sinapsis
- ➔ Hay sobreestimulación M y N
- ➔ Penetran muy bien mucosas y piel sana
- ➔ Principal causa muerte es paro respiratorio

Signos y Síntomas Intoxicación Organofosforados

1.- Muscarínicos
Broncoespasmo (apnea), ↑ secreción bronquial salival, vómitos, diarrea, sudoración, miosis

2.- Placa Motora
Inicialmente fasciculaciones. Luego debilidad muscular
Finalmente parálisis muscular **Paro respiratorio.**

3.- SNC
Inicialmente Excitación. Finalmente fatiga neuronal
Depresión centro respiratorio y vasomotor

Tratamiento de la Intoxicación por C. Órganofosforados

1.- Método Efectivo Resucitación

2.- Atropina (e.v.)
Dosis elevadas, hasta inhibir signos muscarínicos.
No antagoniza efectos del ↑ [ACh] en la placa motora.

**3.- Pralidoxima (e.v.)
Reactivador de AChE**
Separa el organofosforado de la enzima. Contrarresta signos en la placa motora. No pasa la BHE.

