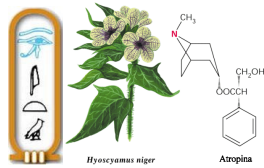


FARMACOLOGÍA

ANTAGONISTAS MUSCARÍNICOS



Prof., Sandro Bustamante

CARACTERÍSTICAS FARMACODINÁMICAS

- Antagonistas competitivos receptores muscarínicos
- Son desplazables por aumento de [ACh]
- Dosis altas (tóxicas) antagonizan receptores nicotínicos

FÁRMACOS ANTIMUSCARÍNICOS



Atropa belladonna



Datura stramonium



ATROPINA

50% *d*-hiosciamina

+

50% *l*-hiosciamina

FÁRMACOS ANTIMUSCARÍNICOS

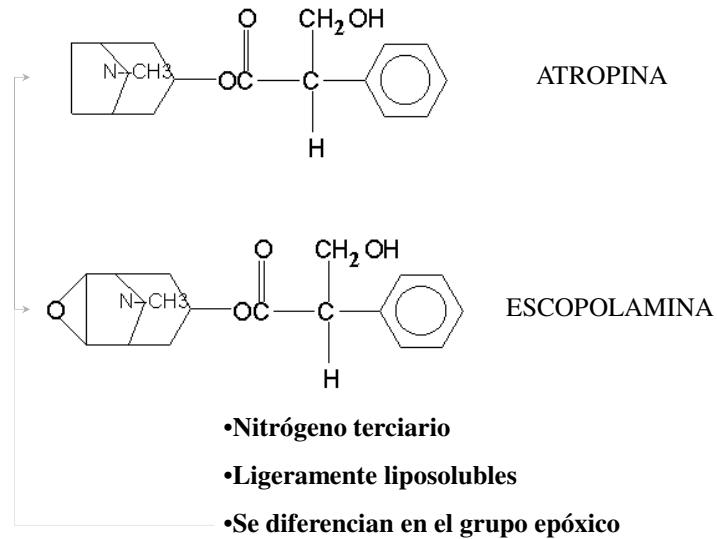


Hyoscyamus niger

ESCOPOLAMINA

l-hioscina

FÁRMACOS ANTIMUSCARÍNICOS



Fármaco Tipo: ATROPINA

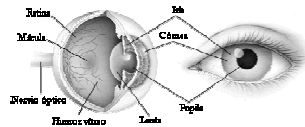
FARMACOCINÉTICA

- Buena absorción *vo* (1 hr)
- Cruza BHE y placentaria
- Excreción renal
- Degradación hepática (esterasas inespecíficas)
- Excreción a la leche materna (<%)

ACCIONES FARMACOLÓGICAS

Fármaco tipo: ATROPINA

SISTEMA OCULAR



•Midriasis (relaja músculo circular)

•Cicloplejía (relaja músculo ciliar)

•Aumento de la presión intraocular (bloqueo del conducto de Schlemm)

Contraindicado en glaucoma



ACCIONES FARMACOLÓGICAS

Fármaco tipo: ATROPINA

SISTEMA NERVIOSO CENTRAL



•Anticinetósico (mejor escopolamina)

•Antiemético

Sobredosis

- Excitación
- Nerviosismo
- Irritabilidad
- Desorientación
- Alucinaciones

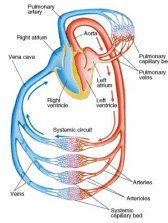
A mayor dosis

- Depresión central
- Coma
- Parálisis bulbar

ACCIONES FARMACOLÓGICAS

Fármaco tipo: ATROPINA

SISTEMA CARDIOVASCULAR



Por bloqueo de la acción vagal:

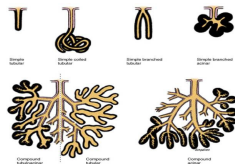
- Taquicardia (cronótropo positivo)
- Vasodilatación cutánea (calor y rubor)
- Acción compleja en músculo liso vascular (endotelio)

A bajas dosis, bradicardia de origen ganglionar

ACCIONES FARMACOLÓGICAS

Fármaco tipo: ATROPINA

GLÁNDULAS (no digestivas)

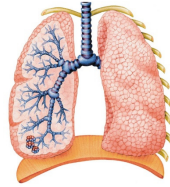


- Disminuye secreción salival acuosa
- Disminución de la sudoración

ACCIONES FARMACOLÓGICAS

Fármaco tipo: ATROPINA

SISTEMA RESPIRATORIO



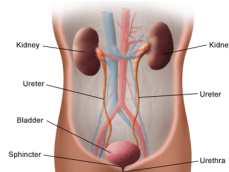
- Broncodilatación
- Disminución movimientos ciliares epitelio bronquial
- Disminución secreciones:
 - nasales
 - faríngeas
 - bronquiales

**Útil en anestesia general
y catarro**

ACCIONES FARMACOLÓGICAS

Fármaco tipo: ATROPINA

SISTEMA UROGENITAL



- Disminuye tono de la vejiga
- Disminuye motilidad de uréteres

Útil en cólicos renales

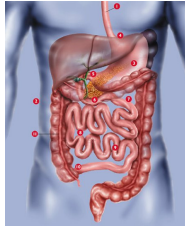
Contraindicado su uso en

- Hipertrofia prostática
- Retención urinaria

ACCIONES FARMACOLÓGICAS

Fármaco tipo: ATROPINA

SISTEMA DIGESTIVO



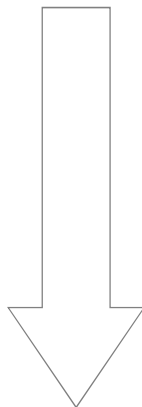
- Disminuye tono músculo liso estómago e intestino
- Disminuye amplitud y frecuencia peristaltismo
- Disminuye tono músculo liso de vesícula y colédoco
- Disminuye secreción ácida gástrica

Util en cólicos intestinales y biliares

ATROPINA

¿Útil en el tratamiento de la úlcera gástrica?

< [atropina]



> [atropina]

INHIBICIONES DOSIS-DEPENDIENTES

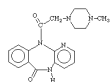
1. Secreciones salivales.
2. Secreciones bronquiales, sudor.
3. Músculo liso vascular.
4. Efectos cardíacos (taquicardia).
5. Midriásis.
6. Visión borrosa.
7. Disminución de la micción.
8. Disminución movimientos gastrointestinales.
9. Secreción gástrica.

ANTIMUSCARÍNICOS DE SÍNTESIS Y SEMISINTÉTICOS

Acción específica sobre subtipos de receptores

INHIBICIÓN SECRECIONES GÁSTRICAS - ÚLCERA

PIRENZEPINA •Antagonista M_1 (ganglio parasimpático)



•Inhibición secreciones ácidas

Sobredosificación • M_2 taquicardia

(acción inespecífica)

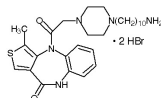
• M_3 glándulas y músculo liso

ANTIMUSCARÍNICOS DE SÍNTESIS Y SEMISINTÉTICOS

Acción específica sobre subtipos de receptores

INHIBICIÓN SECRECIONES GÁSTRICAS - ÚLCERA

TELENZEPINA Antagonista M_1 con afinidad y eficacia
4 a 5 veces mayor que pirenzepina



ANTIMUSCARÍNICOS DE SÍNTESIS Y SEMISINTÉTICOS

Acción específica sobre subtipos de receptores

INHIBICIÓN SECRECIONES GÁSTRICAS - ÚLCERA

- DIFEMANILO
 - PARAPENZOLATO ($-N^+H_4$)
 - TRIMEBUTINA
 - Úlcera, nauseas, vómitos
 - Restablecimiento tránsito intestinal
- } Coadyuvante
úlcera péptica

ANTIMUSCARÍNICOS DE SÍNTESIS Y SEMISINTÉTICOS

Acción específica sobre subtipos de receptores y tejidos

ACCIÓN ANTIESPASMÓDICA

Grupo I - derivados de $+NH_4$

- ANISOTROPINA
- METANTELINA
- OXIFENONIO
- ESCOPOLAMINA (butilbromuro)

ANTIMUSCARÍNICOS DE SÍNTESIS Y SEMISINTÉTICOS

Acción específica sobre subtipos de receptores y tejidos

ACCIÓN ANTIESPASMÓDICA

Grupo I - derivados de $+NH_4$

- Anisotropina
- Metantelina
- Oxifenonio
- Escopolamina (butilbromuro)

Farmacocinética:

- Absorción oral irregular
- No cruzan BHE

Usos clínicos:

- Colon irritable
- Hipermotilidad intestinal

ANTIMUSCARÍNICOS DE SÍNTESIS Y SEMISINTÉTICOS

Acción específica sobre subtipos de receptores y tejidos

ACCIÓN ANTIESPASMÓDICA

Grupo II - derivados de NH_3

- ADIFENINA
- DICICLOMINA
- TERODILINA
- OXIBUTINA

Farmacocinética:

- Baja potencia
- Relajan músculo liso
- Administración oral

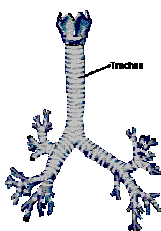
Usos clínicos

- Cólicos y espasmos
- Acción vesical
- Incontinencia urinaria

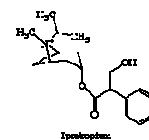
ANTIMUSCARÍNICOS DE SÍNTESIS Y SEMISINTÉTICOS

Acción específica sobre subtipos de receptores y tejidos

VÍAS AÉREAS



- IPRATROPIO (derivado de atropina)
- OXITROPIO (derivado de escopolamina)



- Tienen $+NH_4$
- Acción broncodilatadora
- Disminuyen secreciones bronquiales

ANTIMUSCARÍNICOS DE SÍNTESIS Y SEMISINTÉTICOS

Acción específica sobre subtipos de receptores y tejidos

USO OFTÁLMICO

FÁRMACO Dosis: 1 gota, 1%	MIDRIASIS	CICLOPLEJÍA
ATROPINA (sulfato)	7-10 d	6-12 d
ESCOLPOLAMINA	3-7 d	6-10 d
HOMATROPINA	1-2 d	5-7 d
CICLOPENTOLATO	1 d	1 d
TROPICAMIDA	6 h	6 h

ANTIMUSCARÍNICOS DE SÍNTESIS Y SEMISINTÉTICOS

Acción específica sobre subtipos de receptores y tejidos

COADYUVANTES ENFERMEDAD DE PARKINSON

- | | |
|---|--|
| <ul style="list-style-type: none"> • Cruzan BHE • Derivados de NH₃ • Inhiben sialorrea | <ul style="list-style-type: none"> • BENZHEXOL • BIPERIDENO (en Chile) • BORNAPRINA • PROCICLIDINA • TRIHEXIFENIDILO |
|---|--|

USOS CLÍNICOS DE ANTIMUSCARÍNICOS

Cuadro Resumen

- | | |
|---|---|
| <ul style="list-style-type: none"> • Antiespasmódicos (cólicos biliar, renal) • Úlcera gastroduodenal • Premedicación anestésica • Intervenciones odontológicas • Cinetosis • Exámenes oftalmológicos | <ul style="list-style-type: none"> • Patologías cardiovasculares • Enfermedades respiratorias (EPOC) • Enfermedad de Parkinson • Sobredosis colinérgica • Intoxicación organofosforados • Intox. examen <i>miastenia gravis</i> |
|---|---|

INTOXICACIÓN ATROPÍNICA

10 mg de atropina en niños es mortal.

Se produce por acción fármacos anticolinérgicos y por:

- Antihistamínicos H₁
- Antidepresivos tricíclicos
- Antisicóticos

Síndrome Anticolinérgico

- Periférico
- Central

INTOXICACIÓN ATROPÍNICA

SÍNDROME ANTICOLINÉRGICO PERIFÉRICO

1^{er} Grado

- Serostomía
- Depresión secreciones bronquiales y sudoríparas
- Hipotensión

2^o Grado

- Midriasis
- Cicloplejía (visión borrosa)
- Anomalías conducción cardíaca

3^{er} Grado

- Retención urinaria
- Íleo adinámico

INTOXICACIÓN ATROPÍNICA

SÍNDROME ANTICOLINÉRGICO CENTRAL

- 1^{er} Grado**
- Cambios de humor
 - Ataxia
 - Alteraciones de la marcha

-
- 2^o Grado**
- Distracciones frecuentes
 - Déficit atencional
 - Alteraciones de la memoria

-
- 3^{er} Grado**
- Desorientación
 - Fabulaciones
 - Alucinaciones

INTOXICACIÓN ATROPÍNICA

TRATAMIENTO AGUDO

- Lavados gástricos
- Anticolinesterásico: fisostigmina *iv* ^c/12 h
- Diazepam, en caso de convulsiones