1. IDENTIFICACIÓN DE LA GUIA DE APRENIZAJE

- **Denominación del Programa de Formación**: Técnico en Servicios Farmacéuticos
- **Código del Programa de Formación:**331505
- **Nombre del Proyecto:** Plan de ajuste e implementación de protocolos para la gestión del servicio farmacéutico en los establecimientos de la región.
- **Fase del Proyecto**: ejecucion
- **Actividad de Proyecto**: elaborar protocolos de acuerdo con la selección de los aspectos críticos encontrados según diagnostico
- **Competencia**: surtir productos farmaceuticos
- **Resultados de Aprendizaje Alcanzar**: alistar mercancía teniendo en cuenta estrategias de distribución , escenario de comercialización y normativa establecida.
- **Duración de la Guía:** 54 horas

2. PRESENTACION

- La prestación del servicio farmacéutico en Colombia es de gran importancia para todo el sector salud razón por la cual es nuestro deber "Comprender y verificar la normatividad vigente para el uso correcto de los medicamentos de origen natural , homeopáticos , suplementos dietarios y cosméticos así como prevenir eventos asociados al uso incorrecto de medicamentos y dispositivos médicos desde la atención y dispensación en el servicio farmacéutico teniendo en cuenta su clase ,complejidad, naturaleza y características", a partir de la profundización de los conocimientos y realización de las acciones descritas en la siguiente guía te invito a realizar la exploración de saberes previos, la apropiación del aprendizaje y la aplicación del conocimiento, que conduzcan a alcanzar los Resultados de aprendizaje planteados en esta fase del proyecto y reunir las Evidencias o Actividades de Aprendizaje.

3. FORMULACION DE LAS ACTIVIDADES DE APRENDIZAJE

- Según resultados de la encuesta aplicada al servicio farmacéutico implementar actividades de mejora en los protocolos encontrados. Según normatividad.vigente paralos dispositivos médicos realizar la clasificación según el riesgo (taller).

- Realizar un ensayo descriptivo sobre las funciones y prohibiciones del dispensador según normativdad vigente.

- En la siguiente tabla relaize ejemplos de dispositivos médicos fraudulentos y alterados.
-

Diaspositivo medico	Fraudulento	Alterados

- Ambiente Requerido: Ambiente simulación en salud y simulador.
- Materiales: videobeam , monitor , equipos portátiles , tablero , simulador

4. ACTIVIDADES DE EVALUACIÓN

Evidencias de Aprendizaje	Criterios de Evaluación	Técnicas e Instrumentos de Evaluación
Evidencias de Conocimiento :	Explica la normatividad farmacéutica de acuerdo a los procesos desarrollados en los servicios farmacéuticos. Identifica la documentación y recurso humano requeridos para el funcionamiento de los establecimientos	Cuestionario de Preguntas Lista de chequeo Desempeño / Producto
Evidencias de Desempeño		Lista de chequeo Desempeño / Producto

Evidencias de Producto:	farmacéuticos según normatividad. Conoce las condiciones de infraestructura, dotación y equipos que deben cumplir las áreas del servicio farmacéutico para su funcionamiento y desarrollo de los procesos según normatividad.	Cuestionario de Preguntas Final

5. GLOSARIO DE TERMINOS

Consultar Material de Apoyo en la Plataforma LMS (Black Board).

http://glosario.sld.cu/terminos-farmacologicos/

6. REFERENTES BILBIOGRAFICOS

https://www.google.com/url?sa=t&rct=j&q=&esrc=s&source=web&cd=2&ved=2ahUKEwjvyLCNp-vgAhUix1kKHbKbB68QFjABegQIBBAC&url=http%3A%2F%2Fwww.saludcapital.gov.co%2Fsitios%2FVigilanciaSaludPublica%2FDocuments%2FLegislaci%25C3%25B3n%2F6%2520Otros%2FFORMATOS_RES_004651_de_2005.xls&usg=AOvVaw3OpSF5nxZbIf6Z0aPG2nlo

https://www.invima.gov.co/images/pdf/medicamentos/resoluciones/resolucion%2000147 8%20de%202006.pdf

https://www.sefh.es/bibliotecavirtual/ops/sdmdu.pdf

https://www.sefh.es/bibliotecavirtual/fhtomo1/cap2611.pdf

https://www.invima.gov.co/images/pdf/medicamentos/resoluciones/resolucion-444-de-2008.pdf

https://www.google.com/url?sa=t&rct=j&q=&esrc=s&source=web&cd=1&ved=2ahUKEwjsq87-p-vgAhVIjlkKHaH2AKkQFjAAegQIChAC&url=https%3A%2F%2Fwww.invima.gov.co%2Fprocesos%2Farchivos%2Fprocesos_eliminados%2FCapacitacion_y_asistencia%2F2008%2FVersio

nes%2520anteriores%2FVersion%25201%2FPM06-CAT-G22.ppt&usg=AOvVaw1aw82FxqRDsZ2AfjeMWI-a

http://www.mcg.com.ve/_catalog/unidosis.pdf

https://www.invima.gov.co/images/pdf/medicamentos/resoluciones/resolucion-444-de-2008.pdf

7. CONTROL DEL DOCUMENTO

	Nombre	Cargo	Dependencia	Fecha
Autor (es)	**José Wilson Cabrera. Eduard ivan Piedrahita Velasco.**	**Instructor**	**Salud**	**01 / 10 /2020**

8. CONTROL DE CAMBIOS(diligenciar únicamente si realiza ajustes a la guía)

	Nombre	Cargo	Dependencia	Fecha	Razón del Cambio
Autor (es)					

ANTIINFLAMATORIOS NO ESTEROIDEOS (AINES)

RF. JOHN ALEXANDER ALMENDRA TOMBE

AINES

- Son fármacos utilizados para disminuir el dolor , la inflamación y el aumento de temperatura.

ANALGÉSICOS, ANTIINFLAMATORIOS, ANTIPIRÉTICOS

DOLOR

El **dolor** es una experiencia sensorial y emocional , generalmente desagradable, que pueden experimentar todos aquellos seres vivos que disponen de un **sistema nervioso**.

Es una experiencia asociada a una **lesión tisular** o expresada como si ésta existiera

Fisiopatología del dolor

- **detectores de la señal nociva**: depende de la existencia de neuronas especializadas en la recepción del dolor, denominadas **nociceptores**
- **mecanismos ultra-rápidos de protección**

REFLEJOS: son reacciones rápidas, generadas a nivel de la médula espinal que pueden tener como efecto

  - **una reacción de retirada** (por ejemplo, cuando se retira la mano rápidamente al tocar una superficie ardiente)
  - **una contractura de la musculatura** que bloquea la articulación si se ha producido una lesión articular.

Fisiopatología del dolor

- **mecanismos de alerta general (estrés)**, por activación de los centros de alerta presentes en el tronco cerebral; ello se traduce en un aumento de la vigilancia y de las respuestas cardiovasculares, respiratorias y hormonales_que preparan al organismo a hacer frente a la amenaza (mediante la huida o la lucha)
- **mecanismos de localización** : a nivel del cerebro; la localización es precisa si la lesión se produce en la piel y difusa o incluso deslocalizada si la lesión afecta un tejido profundo

Fisiopatología del dolor

- **mecanismos comportamentales para hacer frente a la agresión**: debido a la activación de centros especializados en el cerebro, aumenta la agresividad y pueden producirse manifestaciones de cólera; estas pulsiones tienen como objetivo movilizar la atención del sujeto e iniciar los comportamientos de huida o lucha para preservar la integridad corporal.
- **mecanismos de analgesia endógenos**: en ciertas circunstancias estos mecanismos permiten hacer frente a la amenaza a pesar de que se hayan sufrido graves heridas.

Componentes de la fisiopatología del dolor

La fisiopatología del dolor tiene **cuatro componentes que son:**

- **La nocicepción**: Es la única etapa común en todas las personas pues es una etapa bioquímica.
- **La percepción**.
- **El sufrimiento**.
- **El comportamiento del dolor.**

Bioquímica de la nocicepciòn

lesión o traumatismo en un tejido

Causado por

estímulos mecánicos, térmicos o químicos

consecuencia

daño celular

desencadenándose una serie de sucesos

producen liberación de **potasio**, **síntesis de bradiquinina** del plasma, y **síntesis de prostaglandinas** en la región del tejido dañado

aumentan la sensibilidad a otras sustancias **productoras del dolor o algógenas.**

Principales sustancias algógenas

SUSTANCIA	FUENTE
• Potasio →	células dañadas
• Serotonina →	trombocitos
• Bradiquinina →	plasma
• Histamina →	mastocitos
• ATP →	células dañadas

Principales sustancias algógenas

SUSTANCIA	FUENTE
• H+	células dañadas/ células inflamatoria
• Prostaglandinas	acido araquidónico (células dañada)
• Leucotrienos	ácido araquidónico (células dañadas)
• Sustancia P	terminaciones libres

DOLOR

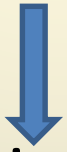
Las sustancias algógenas



inducen la activación de los terminales nociceptivos aferentes



produciendo potenciales de acción



que se propagan hacia el sistema nervioso central (SNC) a través de la médula espinal.

DOLOR

LIBERACIÓN HISTAMINA + SUSTANCIA P

↓

AUMENTA PERMEABILIDAD VASCULAR

↓

GENERANDO EDEMA (INFLAMACIÓN) Y ENROJECIMIENTO ZONA AFECTADA

↓

AUMENTO LOCAL DE HISTAMINA + SEROTONINA

↓

INCREMENTO SUSTANCIA P

↓

AUTOPERPETÚA EL ESTIMULO DOLOROSO

CLASIFICACIÓN DEL DOLOR

Según el tiempo de evolución

- **Dolor crónico:** Es el dolor que dura más de tres meses, como el dolor oncológico.

- **Dolor agudo:** Es el dolor que dura poco tiempo, generalmente menos de dos semanas, como un dolor de muelas, o de un golpe.

TRATAMIENTO

En la actualidad, hay dos líneas de tratamiento del dolor:

- La **terapia farmacológica** consiste en el suministro de fármacos para disminuir el síndrome álgico.
- La **terapia mediante medicina física o electromedicina** consiste en la aplicación de corrientes de distinta índole y ondas sónicas para tratar el dolor.

TRATAMIENTO FARMACOLOGICO

- **Antiinflamatorios no esteroideos – AINES-.**
- **Opioides**
- **Anestésicos lócales**

AINES

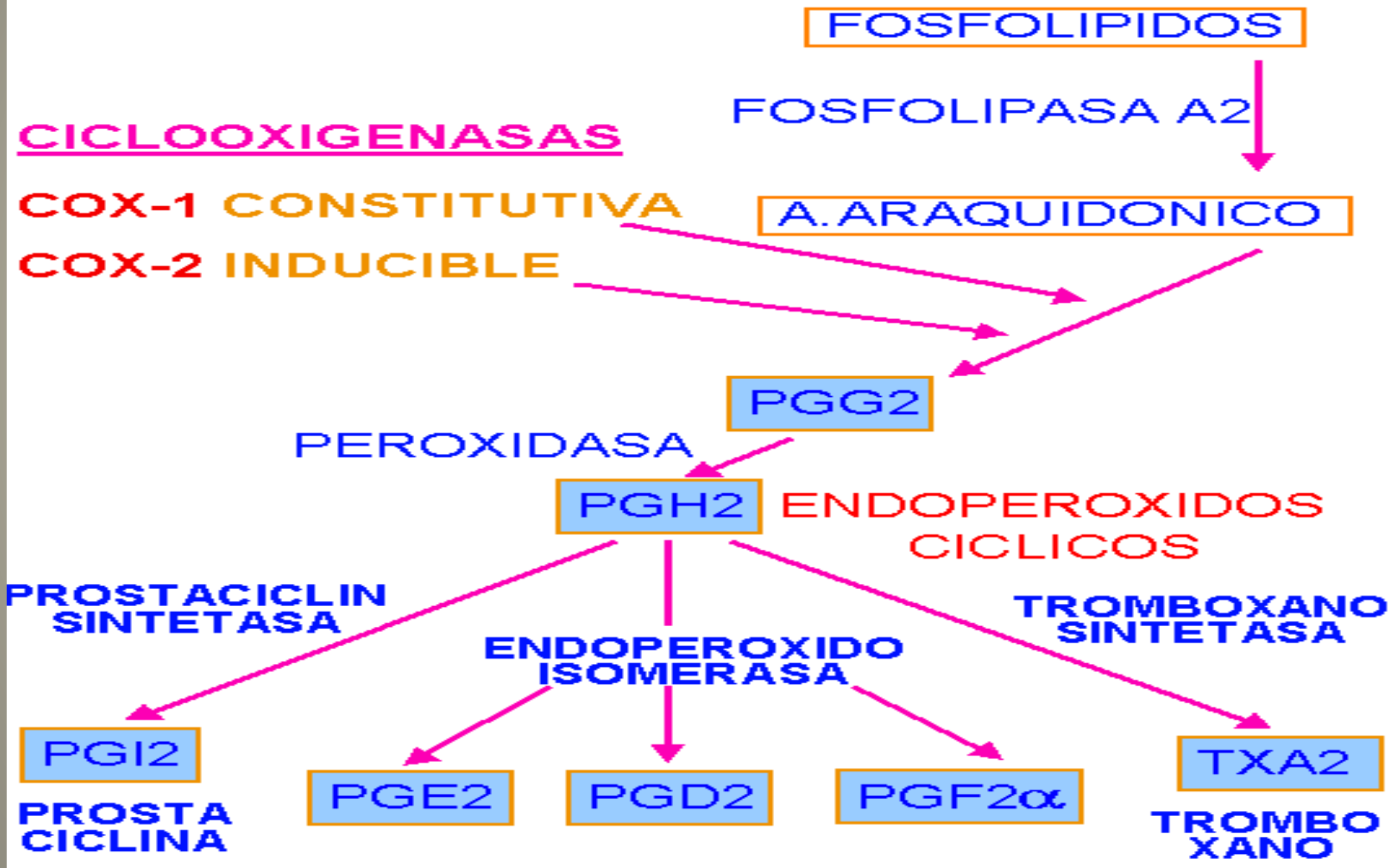
Son un grupo de medicamentos heterogéneo desde el punto de vista químico, pero que comparten muchas propiedades, entre ellas tenemos:

- Mecanismo de acción
- Otros efectos derivados de dicho mecanismo

AINES

- **SELECCIÓN CLÍNICA**
- Eficacia
- Tolerabilidad
- Costo
- Reacciones adversas individuales

ANTIINFLAMATORIOS NO ESTEROIDEOS
MECANISMO DE ACCION



ASPECTOS FARMACOLOGICOS

- El mecanismo de acción de los AINES consiste en la inhibición de la síntesis de prostaglandinas mediante el bloqueo de la enzima ciclooxigenasa (COX).

- Las prostaglandinas, especialmente la E2, producen vasodilatación, aumento de la permeabilidad capilar, eritema, algesia y fiebre.

- Efectos antiinflamatorios, analgésicos y antipiréticos.

CICLOOXIGENASAS

- **Se han identificado dos isoenzimas de la ciclooxigenasa:**

COX -1 y COX-2

- **COX-1:** la encontramos a nivel del riñón, mucosa del estomago, duodeno. Es una isoenzima constitutiva que participa fundamentalmente en la síntesis de PG citoprotectoras.

- **COX-2:**cerebro, pulmón, páncreas, ovarios, placenta; es la forma inducible que interviene en la síntesis y liberación de PG proinflamatorias.

ASPECTOS FARMACOLOGICOS

- La selectividad de los AINES por las ciclooxigenasas es dosis-dependiente.

- La COX -2 puede ser constitutiva en algunos órganos como SNC y los riñones.

- A dosis más altas, el mecanismo de acción de los AINES incluye: modificación de los estadíos iníciales de la inflamación y la producción de citoquinas.

ASPECTOS FARMACOLOGICOS

- La actividad antipirética se da por inhibición de la síntesis de prostaglandinas y modificación de la respuesta a la interleucina-1 (pirógeno endógeno).

- La vía de administración común de estos medicamentos es la oral. También los hay para uso parenteral y de acción local.
- Se unen a proteínas plasmáticas.
- Nivel de absorción: buena
- Buena biodisponibilidad.
- Metabolismo hepático.
- Vía de excreción: renal

CLASIFICACIÓN

- POR SU ESTRUCTURA QUIMICA.

- SELECTIVIDAD POR LAS CICLOOXIGENASAS

CLASIFICACIÓN SEGÚN SU ESTRUCTURA QUIMICA

- **DERIVADOS DEL ACIDO SALICÍLICO**: acido acetilsalicilico (ASA), diflunisal.
- **DERIVADOS DEL ACIDO ACÉTICO**:

  - **derivados del acido fenilacético**: diclofenac.
  - **Derivados del acido indolacético**: acemetacina, indometacina, ketorolac, sulindac.

-**DERIVADOS DEL ACIDO PROPIONICO**: ibuprofeno, ketoprofeno, naproxeno, oxaprozin.

CLASIFICACIÓN SEGÚN SU ESTRUCTURA QUIMICA

- **DERIVADOS DEL ACIDO ANTRANÍLICO Ó FENAMATOS**: acido mefenámico, etofenamato, meclofenamato.

- **DERIVADOS DE LA PIRAZOLONA**: fenilbutazona, dipirona.

- **DERIVADOS DEL OXICAM**: piroxicam, tenoxicam, meloxicam, lornoxicam.

CLASIFICACIÓN SEGÚN SU ESTRUCTURA QUIMICA

- **OTROS**: benzidamina, celecoxib, nabumetona, nimesulide, fenbufen, lumiracoxib.

EFECTOS

- ACCIÒN ANTIPIRÈTICA
- ACCIÒN ANALGÈSICA
- ACCIÒN ANTIINFLAMATORIA
- ACCIÓN ANTITROMBÓTICA

REACCIONES ADVERSAS

- **Gastrointestinales:** nauseas, vómito, dolor en epigastrio, gastritis, úlceras y sangrados digestivos.
- **Respiratorias:** pueden precipitar crisis de broncoespasmos en pacientes predispuestos.
- **Reacciones de hipersensibilidad**: más común en pacientes con antecedentes alérgicos de asma y rinitis.
- **Hepático**: alteraciones hepáticas; sulindac y diclofenac.
- **Renales**: pueden disminuir la función renal en pacientes predispuestos.

REACCIONES ADVERSAS

- **Cardiovasculares**: inhibición de la agregación plaquetaria y aumento del tiempo de sangrado.
- **hematológicos:** especialmente con pirazolonas; agranulocitosis y anemia aplástica.
- **Sistema nervioso**: generalmente en dosis altas; vértigo, confusión, psicosis, depresión, somnolencia e insomnio.
- **Embarazo y lactancia**: pueden prolongar el trabajo de parto, inducir el cierre precoz del ductus arterioso y aumentar el sangrado.

INTERACCIONES

- Los AINES aumentan la actividad de los anticoagulantes y de las sulfonilúreas.

- Disminuyen la eficacia de casi todos los antihipertensivos.

- Con los corticosteroides y el alcohol aumenta el potencial ulcerogénico.

DERIVADOS DEL ACIDO SALICÍLICO

Representante: acido acetilsalicílico

- Es un acido orgánico simple.
- Se absorbe rápidamente del estómago y el duodeno.
- Alcanza concentración plasmática máxima en 1 a 2 horas.
- Su velocidad de excreción se aumenta con la alcalinización de la orina.
- El ASA inhibe de manera irreversible la COX plaquetaria, de modo que su efecto antiplaquetario dura de 8 a 10 días.

DERIVADOS DEL ACIDO SALICÍLICO

- **Usos clínicos**:

- El ASA disminuye la incidencia de ataques de isquemia cerebral transitoria, angina inestable, trombosis de arterias coronarias con infarto miocardico.
- Analgésico y antiinflamatorio en general.

- **EFECTOS ADVERSOS**: principalmente problemas gastrointestinales.

INVESTIGAR

1. CARACTERISTICAS PRINCIPALES DE LOS FÁRMACOS DERIVADOS DEL ACIDO ACÉTICO Y DEL ACIDO PROPIÓNICO.

2. EXPLIQUE PORQUE EL PARACETAMOL Ó ACETAMINOFEN NO SE CONSIDERA UN AINES, EXPLIQUE EL MECANISMO DE ACCIÓN.

3. MENCIONE LAS CARACTERISTICAS FARMACOCINETICAS Y FARMACODINAMICAS DEL ACETAMINOFEN.

DERIVADOS DEL ACIDO ANTRANÍLICO Ó FENAMATOS

- Los efectos antiinflamatorios de este tipo de fármacos resultan de una inhibición periférica de la síntesis de prostaglandinas producida por la inhibición de la enzima ciclooxigenasa 1 y 2.

Las prostaglandinas sensibilizan los receptores del dolor y su inhibición es la responsable de los efectos analgésicos.

- El representante es: acido mefenámico, pero también están: acido meclofenamico , tolfenamico , etofenámico.
- Como consecuencia de la inhibición de las prostaglandinas, producen una reducción de la citoprotección gastrointestinal y una cierta inhibición de la agregación plaquetaria.

DERIVADOS DEL ACIDO ANTRANÍLICO Ó FENAMATOS

- La absorción por el tracto gastrointestinal es rápida y completa con unas concentraciones máximas que se obtienen entre las 2 y 4 horas para el ácido mefenámico.

- el alimento disminuye esta absorción en un 26% produciéndose las concentraciones plasmáticas máximas a las 3-4 horas.
- El metabolismo hepático tiene lugar sobre todo mediante oxidación. El fármaco y sus metabolitos se excretan sobre todo en la orina (70%) y un 20-30% se elimina en las heces.
- No se requieren reajustes en las dosis en caso de insuficiencia renal.

DERIVADOS DEL ACIDO ANTRANÍLICO Ó FENAMATOS

- **Las reacciones adversas más frecuentes** :

- dispepsia o malestar epigástrico,
- diarrea profusa, acompañada de inflamación intestinal,
- vómitos, que pueden provocar deshidratación e insuficiencia renal.
- Somnolencia, cefaleas y mareo pueden aparecer con cierta frecuencia.

- **Con menos frecuencia**: reacciones de hipersensibilidad, reacciones hematológicas , convulsiones.

DERIVADOS DE LA PIRAZOLONA

En este grupo se encuentran algunos de los fármacos más antiguos utilizados como analgésicos en terapéutica.

- Con fines preferentemente analgésico y antitérmico se emplean el **metamizol** o **dipirona** y la **propifenazona** (isopropilantipirina).

- con fines antiinflamatorio y analgésico se utiliza la **fenilbutazona.**

DERIVADOS DE LA PIRAZOLONA

El metamizol y la propifenazona

- La acción analgésica es dosis-dependiente, alcanzándose un máximo con metamizol a la dosis de 2 g
- El metamizol es un analgésico comparable al AAS y superior al paracetamol, a igualdad de base y vía de administración, en dolores agudos de tipo moderado/medio.
- En comparación con el AAS es menos lesivo para la mucosa gástrica y no provoca complicaciones hemorrágicas (ya que, aunque inhibe la ciclooxigenasa plaquetaria y la síntesis del TXA2, dicha inhibición es competitiva).
- El metamizol ejerce una ligera acción relajante de la musculatura lisa, por lo que resulta especialmente útil en dolores de tipo cólico, solo o asociado a fármacos espasmolíticos o anticolinérgicos.

DERIVADOS DE LA PIRAZOLONA

- El metamizol ejerce una ligera acción relajante de la musculatura lisa, por lo que resulta especialmente útil en dolores de tipo cólico, solo o asociado a fármacos espasmolíticos o anticolinérgicos.

Metamizol

- Puede provocar agranulocitosis, por anticuerpos antileucocitarios específicos o anemia aplásica. Puede producir, además, otras leucopenias, trombocitopenias y reacciones cutáneas.

- Su acción sobre la mucosa gástrica es escasa, en comparación con otros AINE, aunque forzando la dosis de metamizol (p. ej., uso frecuente de la ampolla de 2 g por vía oral) llega a producir claras lesiones gástricas.

DERIVADOS DE LA PIRAZOLONA

Metamizol

- En administración IV rápida puede producir calor, rubor, facial, palpitaciones, hipotensión y náuseas.
- En uso crónico, no está exento de producir alteraciones renales

- A dosis altas potencia el efecto de fármacos depresores del SNC.

- En la intoxicación aguda puede llegar a provocar convulsiones, coma, paro respiratorio y cuadros de insuficiencia hepática.

propifenazona

produce reacciones de hipersensibilidad con cierta frecuencia, aunque al parecer produce menos efectos adversos hematológicos y digestivos.

DERIVADOS DE LA PIRAZOLONA

FENILBUTAZONA

- La fenilbutazona posee buena actividad antiinflamatoria, analgésica, antitérmica y uricosúrica.

- El riesgo de producir discrasias sanguíneas especialmente anemia aplásica y, en menor grado, agranulocitosis y trombocitopenia que pueden aparecer días o semanas tras suspender el tratamiento, es superior al de cualquier otro AINE, especialmente en ancianos, y se encuentra en función de la duración del tratamiento.

- Puede producir también reacciones de hipersensibilidad.

DERIVADOS DE LA PIRAZOLONA

FENILBUTAZONA

- Presenta también las clásicas alteraciones digestivas.

- Puede producir retención de agua y sodio, con formación de edemas y descompensación de una insuficiencia cardíaca o agravamiento de una hipertensión renal.

- La fenilbutazona puede, en ocasiones, provocar lesión hepática, hematuria, proteinuria y otras lesiones renales.

DERIVADOS DEL OXICAM

MELOXICAM

- Es una enolcarboxamida relacionada con el piroxicam que inhibe de manera preferencial a la COX-2 con respecto a la COX-1, en particular a su dosis terapéutica más baja de 7.5mg/día. No es tan selectivo como el celecoxib.

- Se usa en enfermedades reumáticas y en el tratamiento de la osteoartritis.

- Se vincula con menos síntomas gastrointestinales y menos efectos sobre la función plaquetaria.

DERIVADOS DEL OXICAM

- El meloxicam se administra por vía oral, aunque también se puede administrar por vía intramuscular o rectal.

- El meloxicam se metaboliza extensamente por el sistema enzimático CYP2C9 .

- El 43% de la dosis administrada se excreta en la orina, sobre todo en forma de metabolitos, mientras que el resto se excreta en las heces.

CELECOXIB

- Es un inhibidor de COX – 2, casi 10 a 20 veces más selectivo para ésta que para COX-1.

- Se vincula con menos úlceras detectadas por endoscopia que casi todos los demás AINES.
- Puede causar exantema.
- No afecta la agregación plaquetaria a dosis habituales.
- Interactúa ocasionalmente con warfarina.
- Los demás efectos adversos producidos por los AINES se pueden presentar, especialmente eventos trombóticos cardiovasculares.

NIMESULIDA

- Es una sulfoanilida que posee actividad analgésica (similar al ibuprofeno y superior a la indometazina), antiinflamatoria (similar a la de la indometazina, diclofenaco, piroxicam o ibuprofeno) y antitérmica (superior a la indometazina, aspirina, ibuprofeno o paracetamol).
- La nimesulida se absorbe de forma rápida y casi completa por vía oral (por vía rectal, su biodisponibilidad cae al 70 %).

- Se fija intensamente a las proteínas plasmáticas (99%).
- Se elimina en su mayor parte con la orina (70 %) y heces (20 %).
- La semivida de eliminación oscila entre 1,5 y 5 horas.

NIMESULIDA

Los efectos secundarios más frecuentes son, como con otros AINE:

- A nivel gastrointestinal : epigastralgia, pirosis, diarrea y vómitos en el 5-8 % de los pacientes

- Dermatológica: erupción cutánea y prurito.

- En el SNC: mareo, somnolencia y cefaleas.

NIMESULIDA

- La nimesulida es eficaz en el dolor, inflamación o fiebre. Parece que es especialmente útil en pacientes hipersensibles a la aspirina o a otros AINE y en pacientes asmáticos.

- Se administra por vía oral o rectal (100 y 200 mg 2 veces al día, respectivamente, en adultos). La dosis correspondiente en niños es de 5 mg/kg/día en 2 o 3 tomas, en forma de suspensión, gránulos o supositorios.

NABUMETONA

- Es el único AINE no acido en uso actual.
- Se convierte al derivado activo de acido acético en el cuerpo.
- Se administra como profarmaco cetónico que simula en estructura al naproxeno.
- Tiene una vida media de mas de 24 horas por eso se dosifica una vez al día.
- Sus propiedades son similares al de otros AINES pero es más lesivo para el estómago cuando se administra a dosis de 1000mg/día.
- Es un fármaco muy costoso.
- Puede causar seudoporfiria y fotosensibilidad; además de los otros efectos adversos referidos de los AINES.

TALLER DE AINES

- EXPLIQUE LAS CARACTERISTICAS DE LOS OTROS GRUPOS DE AINES NO VISTOS EN CLASE.

- EXPLIQUE POR QUE LOS AINES TIENEN ACCIÓN ANTIPIRETICA, ANTITROMBOTICA, ANTIINFLAMATORIA Y ANALGÉSICA.

DIURETICOS

RF. JOHN ALEXANDER ALMENDRA T.
INSTRUCTOR
CEL: 3103980271
jaalmendra@sena.edu.co

Definición de diuréticos

- son fármacos que actúan a nivel renal estimulando la eliminación de agua.

  (en realidad incrementan la tasa de excreción de Na+, ión que se acompaña con un anión y con agua).

DEFINICIÓN DE DIURETICOS

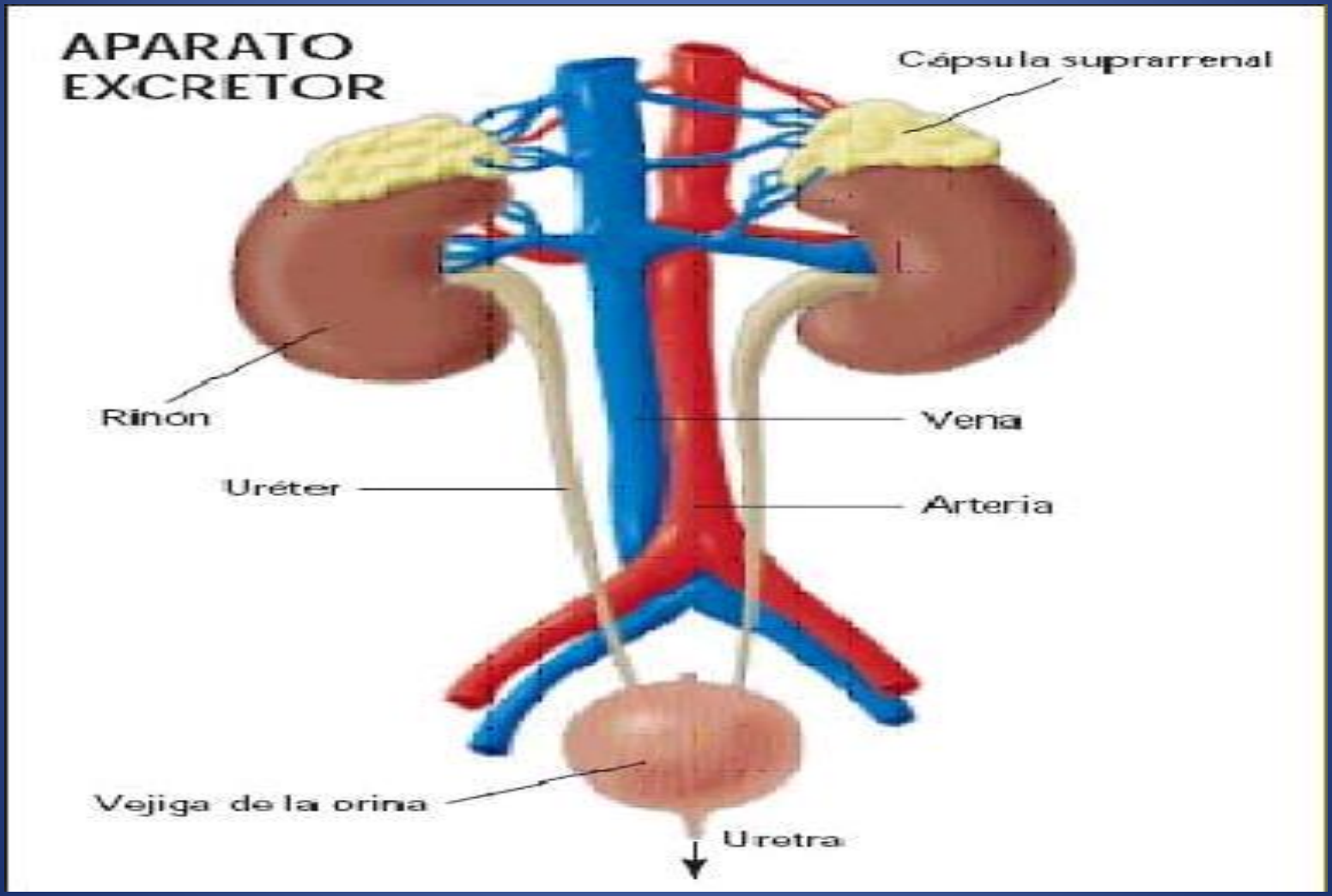
BLOQUEAN LA REABSORCIÓN DE SODIO



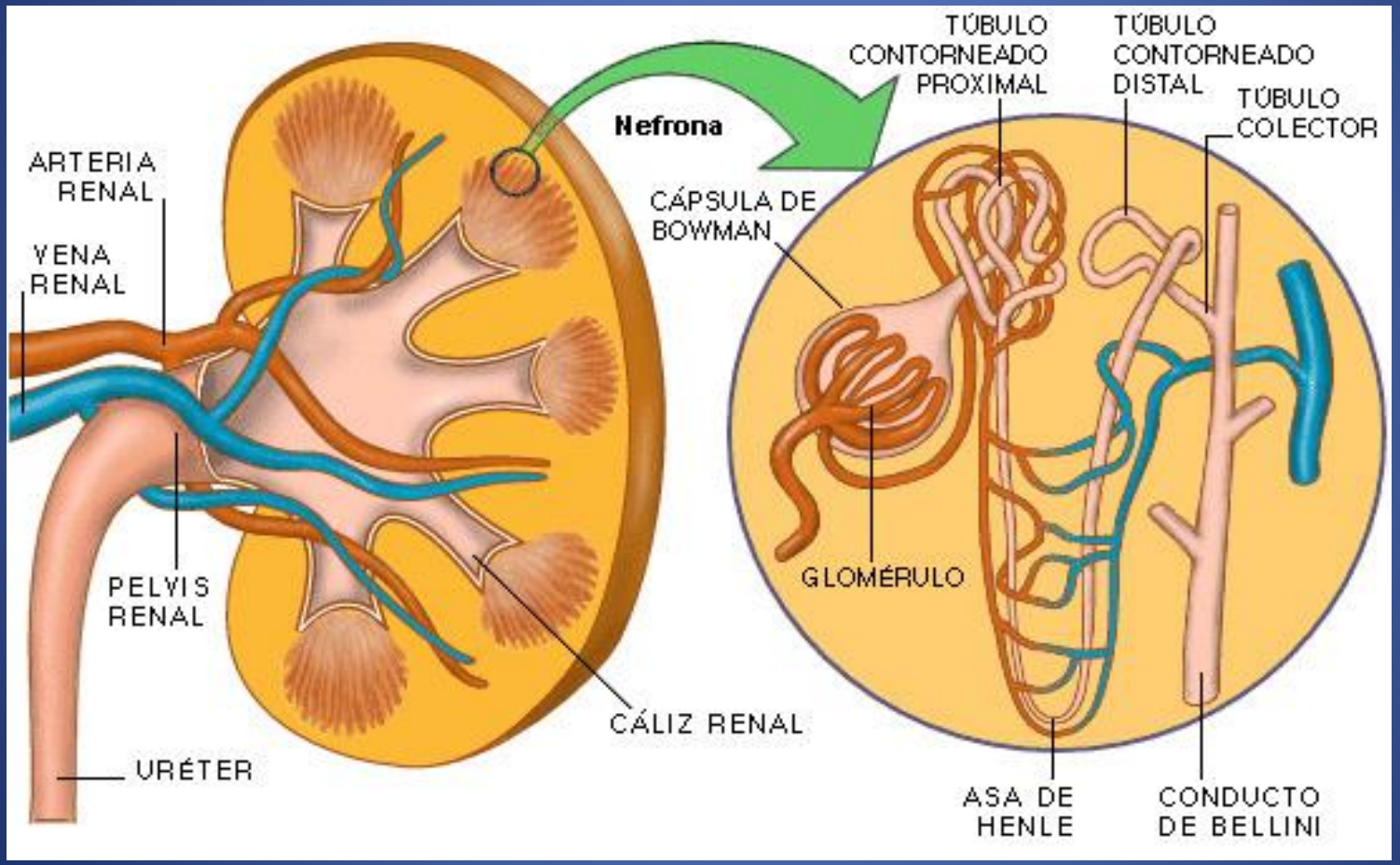
AUMENTO EN LA PERDIDA DE SAL Y AGUA

DISMINUCIÓN DEL VOLUMEN PLASMATICO

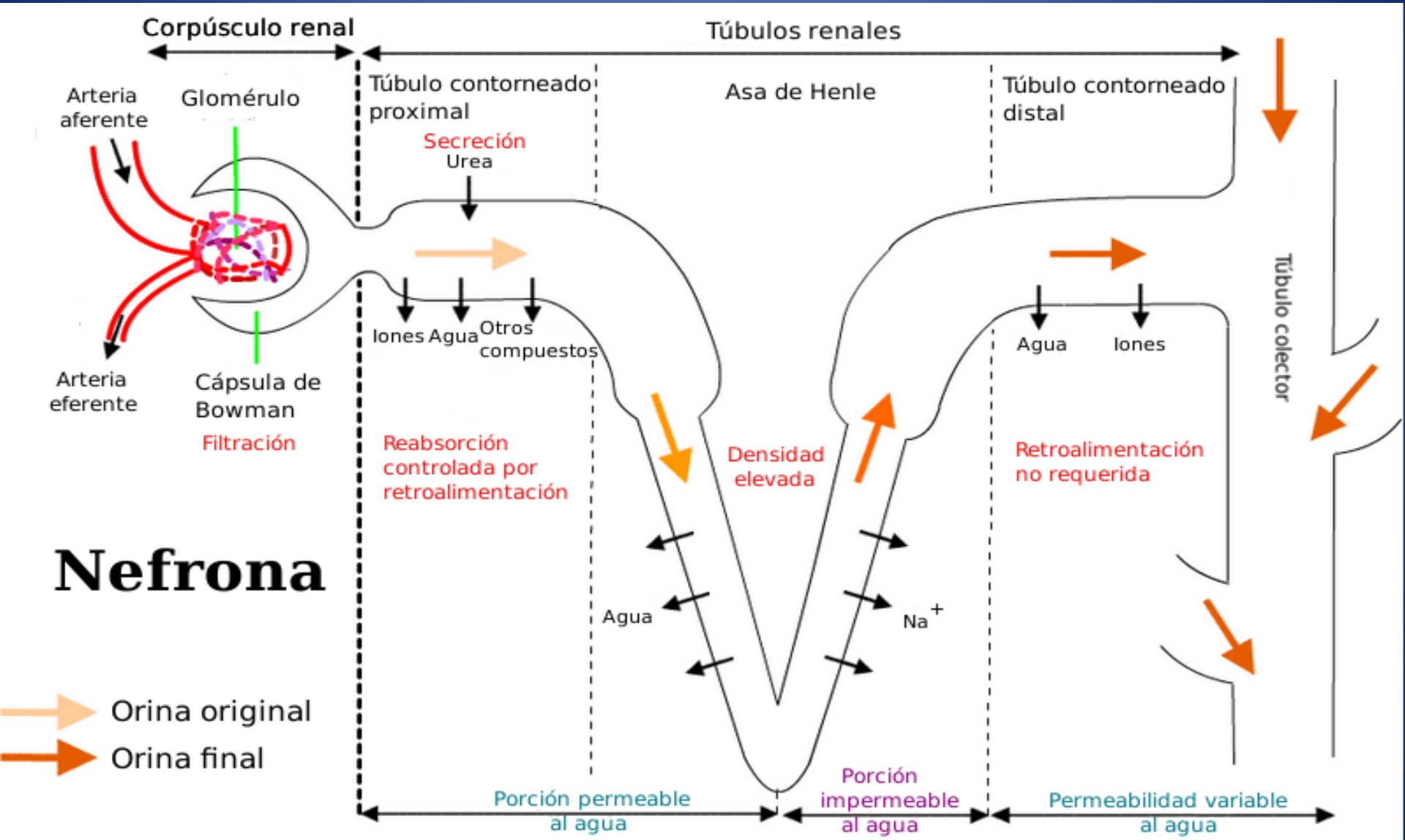
APARATO URINARIO



NEFRONA


Nefrona
ARTERIA RENAL
VENA RENAL
PELVIS RENAL
URÉTER
CÁLIZ RENAL
TÚBULO CONTORNEADO PROXIMAL
TÚBULO CONTORNEADO DISTAL
TÚBULO COLECTOR
CÁPSULA DE BOWMAN
GLOMÉRULO
ASA DE HENLE
CONDUCTO DE BELLINI

FUNCIONAMIENTO DE LA NEFRONA



CLASIFICACIÒN DE LOS DIURETICOS

- - DIURETICOS TIPO TIAZIDAS
- - DIURETICOS DEL ASA
- - DIURETICOS AHORRADORES DE POTASIO
- - DIURETICOS OSMOLITICOS

DIURETICOS TIPO TIAZIDAS

- A este grupo pertenecen fármacos como:

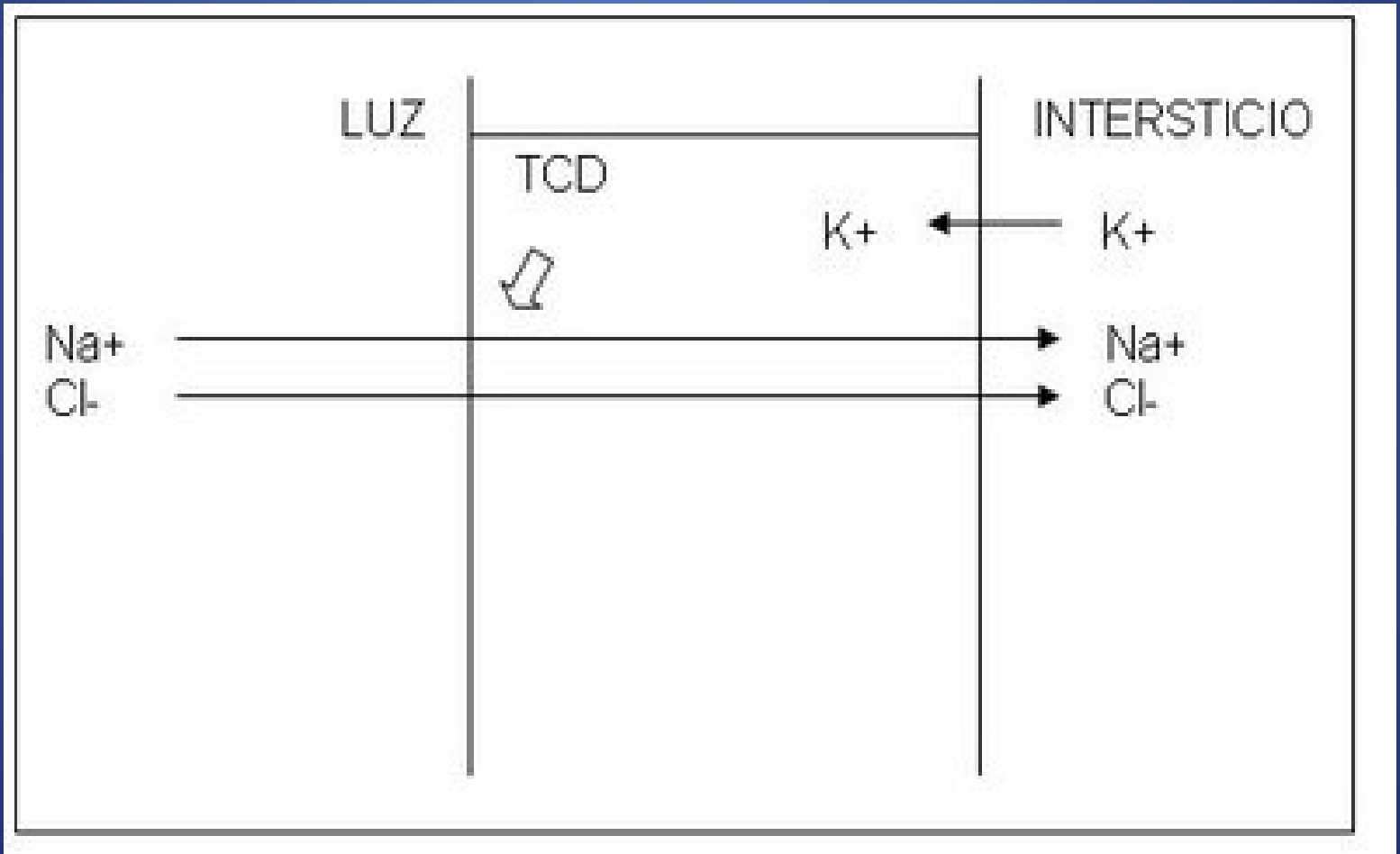
- Hidroclorotiazida
- Butiazida - bendroflumetiazida
- Ciclotiazida - clopamida
- Clorotiazida - metilclorotiazida
- Clortalidona - politiazida
- Metolazona - indapamida

MECANISMO DE ACCIÒN

- Bloquean el co-transportador de Na/Cl de las células del túbulo contorneado distal.
- Hay disminución de la reabsorción de iones.

Esto hace que se acumule sodio en las paredes distales de la nefrona.

Condición normal



DIURETICOS DEL ASA

- A este grupo pertenecen:

- furosemida

- Bumetanida

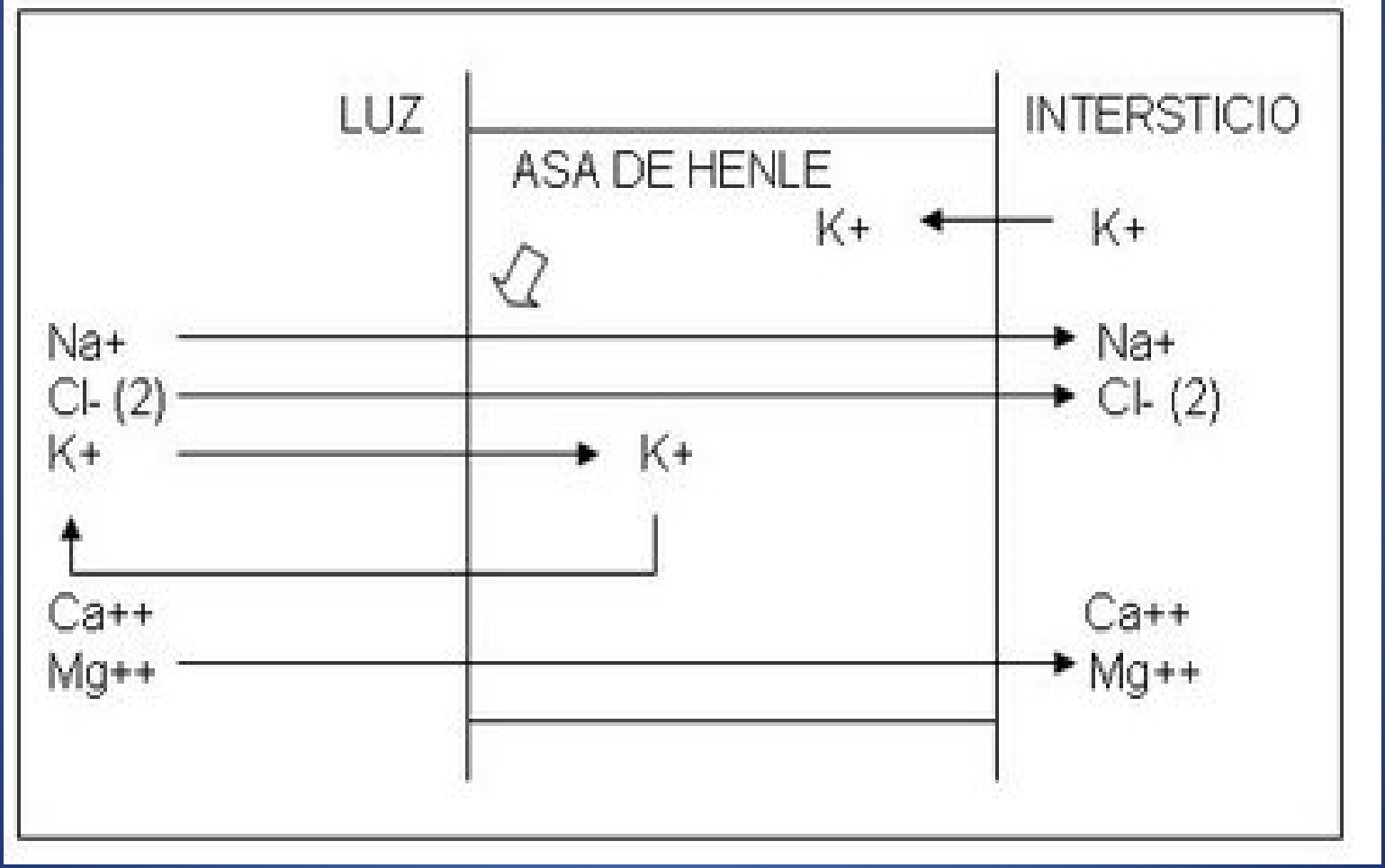
- torasemida

MECANISMO DE ACCIÒN

- Inhiben el transporte de sodio, potasio y cloro, y reducen la diferencia de potencial positiva en la luz tubular del Asa de Henle (ahí es donde bloquean ese movimiento de iones).

- La diuresis resultante va acompañada además de excreción aumentada de potasio, magnesio,, hidrogenos, fosfatos y bicarbonato.
- Produce un efecto diurético rápido e intenso.

Condición normal



AHORRADORES DE POTASIO

- A este grupo pertenecen:
- Espironolactona

- Amiloride

- triamterene

MECANISMO DE ACCIÒN

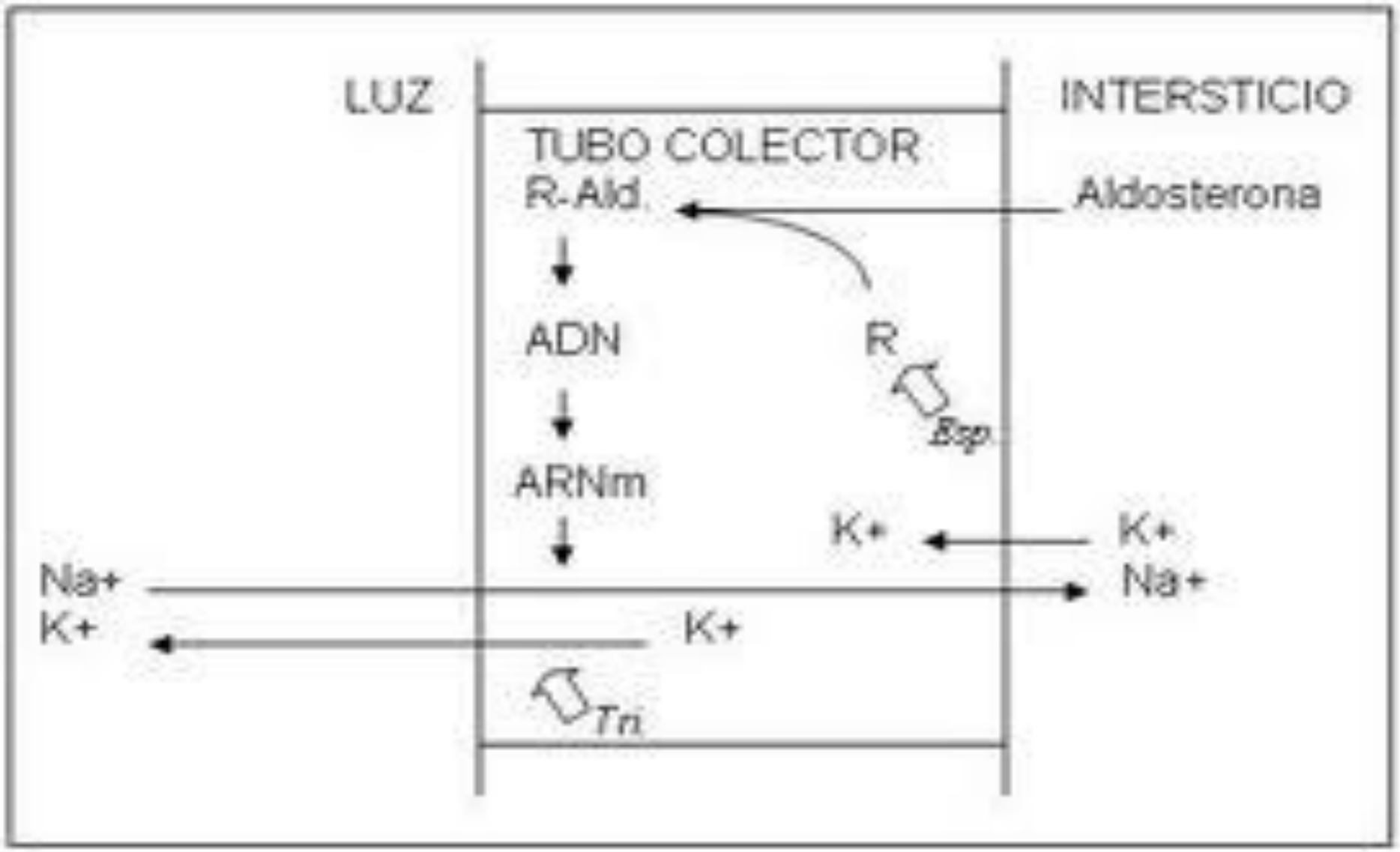
- ***Espironolactona***

  Sitio de acción: Túbulo contorneado distal (TCD) y tubo colector.

  Mecanismo de acción: antagonista competitivo de la aldosterona.

  Es análoga a la aldosterona, por lo que se comporta como un antagonista reversible de los receptores citoplasmáticos ubicados en las porciones final del TCD e inicial del tubo colector. De esta manera, al inhibir la síntesis de bombas Na+ / K+, se produce una disminución de la reabsorción de Na+ y de la secreción de K+.

Mecanismo de acción de la espironolactona



MECANISMO DE ACCIÒN

- ***Triamterene y amiloride***

  Sitio de acción similar a la espirinolactona.

  Mecanismo de acción: inhibe la bomba Na+ / K+.

  Inhibe las bombas Na+ / K+ sintetizadas por inducción de la aldosterona en las porciones final del TCD e inicial del tubo colector. De esta manera, se produce una disminución de la reabsorción de Na+ y de la secreción de K+.

DIURETICOS OSMOLITICOS

- A este grupo pertenece el MANITOL.

MECANISMO DE ACCIÒN

- ***Manitol***

  Sitio de acción: Luz tubular.

  Mecanismo de acción: osmosis.

  Produce un efecto diurético característicamente rápido. Su efecto se debe a que al ser una sustancia osmóticamente activa que se filtra fácilmente por el glomérulo y que no se reabsorbe, retiene agua a lo largo de la nefrona.

MECANISMO DE ACCIÒN

- Cuando el manitol se encuentra en la sangre aumenta la osmolaridad del plasma y por tanto extrae agua desde los compartimientos intersticiales e intracelulares, expande el espacio intravascular, inhibe la liberación de renina y disminuye la viscosidad sanguínea.

ESTUDIO DE LOS DIURETICOS MAS UTILIZADOS

DIURETICOS TIPO TIAZIDAS

representante: hidroclorotiazida tab. 25 y 50mg

La mayoría de las tiazidas se absorben bien por el TGI.

En pacientes hipertensos reduce su presión arterial debido a la acción diurética con disminución del volumen plasmático y del gasto cardiaco.

DIURETICOS TIAZIDAS

- **ACCIÓN DIURETICA**: 1 ó 2 horas después de la administración oral, y dura entre 6 y 36 horas.
- Hidroclorotiazida: 8 horas

- **REACCIONES ADVERSAS:** hipokalemia, hipomagnesemia.

DIURETICOS TIAZIDAS

- **USOS**

- **hipertensión**: las tiazidas están consideradas en la primera línea de tratamiento de la hipertensión arterial; se recomiendan dosis no superiores a 25 mg/día en el caso de la hidroclorotiazida. En asociaciones se recomiendan dosis de 6.25 – 12,5mg/día.

DIURETICOS TIAZIDAS

- **USOS**

- **EDEMAS :** mejoran los síntomas de la disnea, la congestión y los signos de edema periférico en pacientes con insuficiencia cardiaca.

- **Diabetes insípida:** disminuyen hasta un 50% el volumen de orina en pacientes con diabetes insípida.

DIURETICOS DEL ASA

- **Furosemida**: el mas usado
- Bumetanida y torasemida

- Los diuréticos del asa tienen una absorción gastrointestinal con biodisponibilidad entre el 60 -80%
- Se excretan por orina y bilis.
- Efecto diurético: 4 y 8 horas, después de 30min de la administración oral.

DIURETICOS DEL ASA

- Si la administración es IV el efecto se manifiesta después de los 5 minutos máximo 30min y dura 2 horas.
- La administración IM tiene un comportamiento intermedio.
- **REACCIONES ADVERSAS**: trastornos hidroelectroliticos (ej: hipokalemia, hiponatremia).

DIURETICOS DEL ASA

- **REACCIONES ADVERSAS**: ototoxicidad asociada a sobredosis ó administración IV rápida.
- **USOS:**

- **Edemas asociados con insuficiencia cardiaca, enfermedad renal y hepática.**
- **Hipertensión arterial**
- **Diuresis forzada**
- **hipercalcemia**

DIURETICOS DEL ASA

PRESENTACIONES COMERCIALES

FUROSEMIDA: tabletas de 20 y 40mg, ampollas de 20mg

TORASEMIDA: tabletas de 2.5mg y ampollas de 10mg

DIURETICOS AHORRADORES DE POTASIO

- **ESPIRONOLACTONA**

- **absorción**: TGI se metaboliza en el hígado.
- **excreción**: riñón y bilis.
- Su efecto diurético persiste por 2 a 3 días.
- **Reacciones adversas**: desordenes gastrointestinales, hiperkalemia, cefalea, confusión y somnolencia.

DIURETICOS AHORRADORES DE POTASIO

- **USOS**

- EDEMAS
- HIPERTENSIÓN ARTERIAL
- INSUFICIENCIA CARDIACA CONGESTIVA
- HIPERALDOSTERONISMO PRIMARIO

PRESENTACIÓN: tab. De 25 y 100mg; también asociadas con diuréticos tiazídicos.

DIURETICOS AHORRADORES DE POTASIO

- **AMILORIDE**

- No inhibe competitivamente la aldosterona y su actividad diurética es independiente de ella.
- Por eso no es útil cuando existe hiperaldosteronismo.
- 50% de la dosis administrada se absorbe por vía oral y los alimentos disminuyen este porcentaje.

DIURETICOS AHORRADORES DE POTASIO

- El amiloride no sufre metabolismo, se elimina inalterado por la orina.

- Efecto diurético: se evidencia en 2 a 4 horas.

- Reacciones adversas: reacciones adversas serias son escasas, cefaleas, trastornos gastrointestinales.

DIURETICOS AHORRADORES DE POTASIO

usos del amiloride:

- **Edema e hipertensión arterial**: específicamente para prevenir la hipokalemia e hipomagnesemia inducidas por otros diuréticos.
- **Hipercalciuria y diabetes insípida inducida por litio:** se usa amiloride en asociación con hidroclorotiazida.
- **Presentación:** amiloride 5mg + hidroclorotiazida 50mg

DIURETICOS AHORRADORES DE POTASIO

TRIAMTERENE

Actúa por un mecanismo similar al amiloride, pero no posee actividad hipotensora.

- También se comercializa combinado con hidroclorotiazida.
- Tiene extenso metabolismo hepático dando metabolitos activos que se excretan por la orina.

DIURETICOS AHORRADORES DE POTASIO

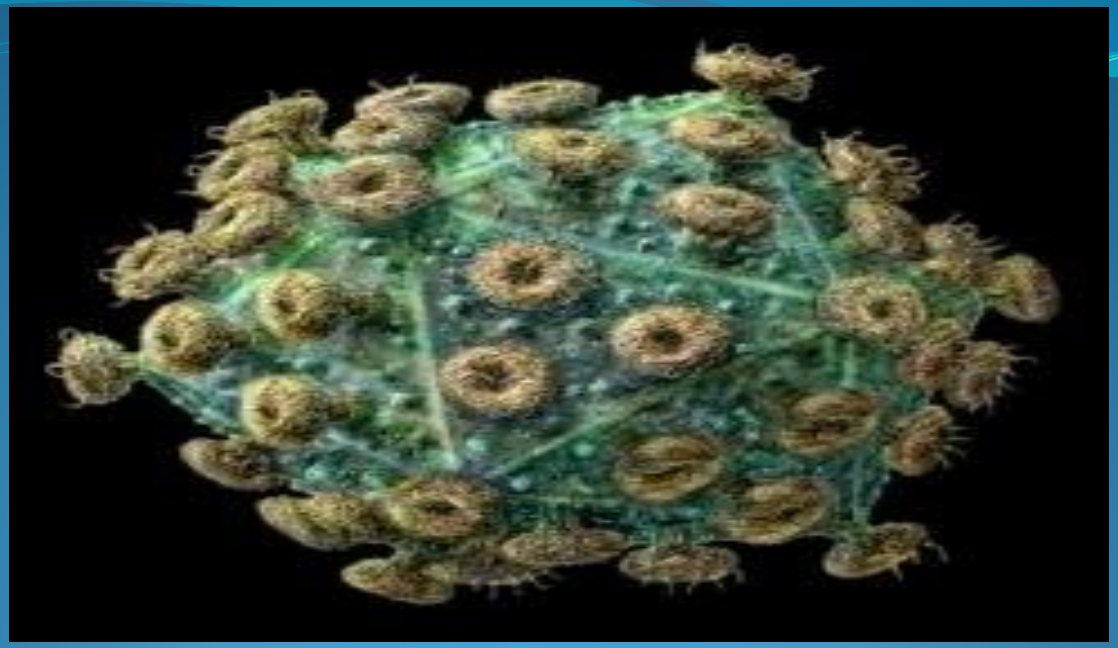
- **TRIAMTERENE**
- **Reacciones adversas**: trastornos GI, calambres, mareos, puede producir anemia megaloblastica y defectos congénitos ya que es un antagonista del acido fólico.

DIURETICOS OSMÓLICOS

- **MANITOL**: fco ó bolsa de 500ml al 20%.

- **Efecto diurético**: ocurre 1 a 3 horas después de la administración IV y persiste de 3 a 8 horas después de suspenderla.
- **Reacciones adversas**: trastornos hidroelectroliticos, vómito, cefalea, vértigo.

MUCHAS GRACIAS



ANTIRRETROVIRALES

RETROVIRUS

- Son virus con envoltura que presentan un genoma de ARN monocatenario de cara y se replican de manera inusual a través de una forma intermedia de ADN bicatenario.

- La característica principal que particulariza a los retrovirus es que **su genoma (es decir, su material genético) está constituido por ARN en lugar de ADN**, al contrario que en el resto de virus.

RETROVIRUS

- Para infectar a una célula, los retrovirus deben traducir su **ARN** en **ADN** e insertarlo dentro del ADN propio de la célula a infectar. Para conseguirlo usan una enzima específica:

TRANSCRIPTASA INVERSA

RETROVIRUS

- Normalmente, en las células, la información genética va del ADN de los cromosomas a las proteínas, vía ARN mensajero.

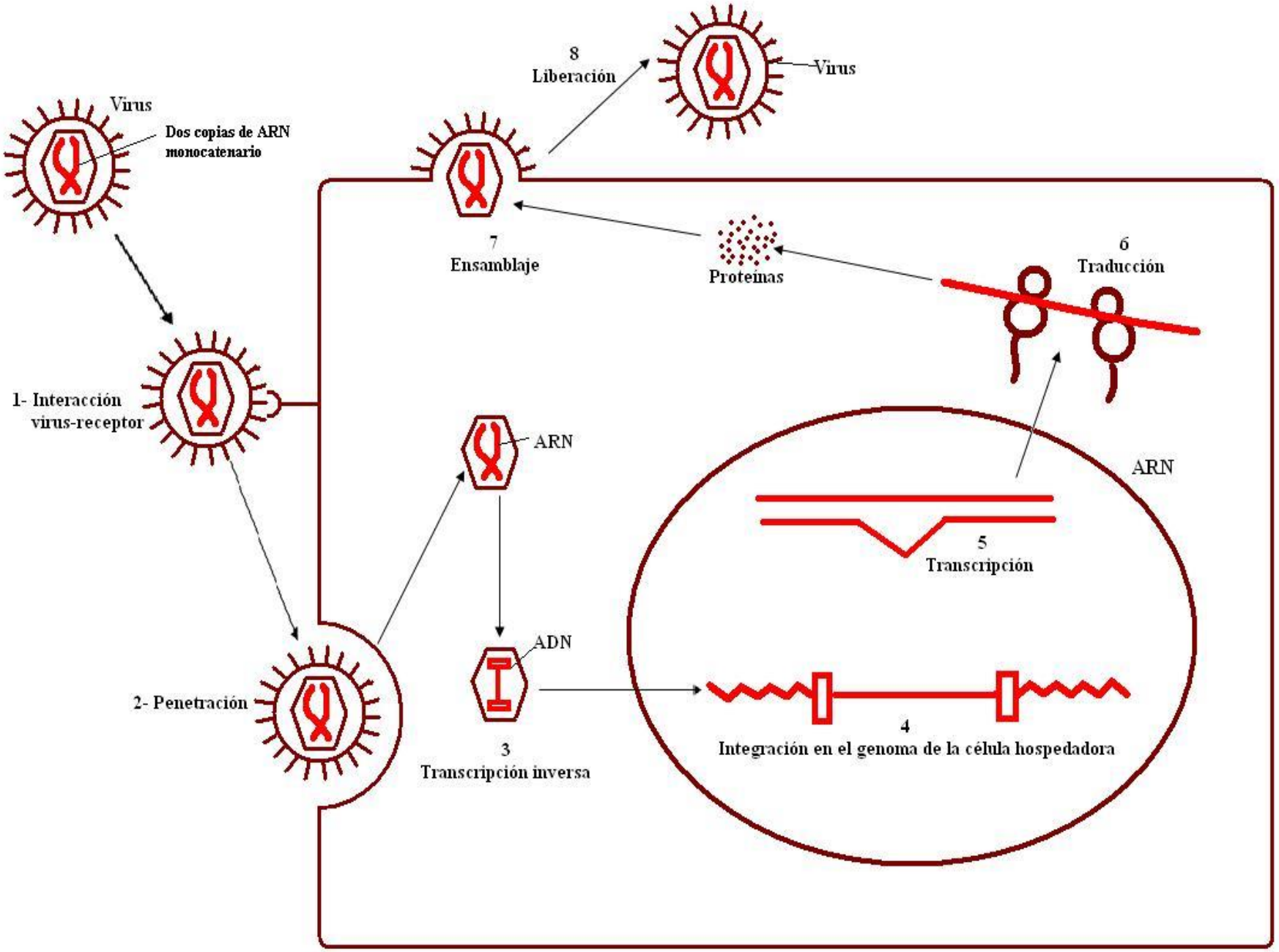
- En los retrovirus se produce la transcripción retrógrada, del ARN al ADN, por acción de la transcriptasa inversa. De ahí el origen de su nombre.

RETROVIRUS

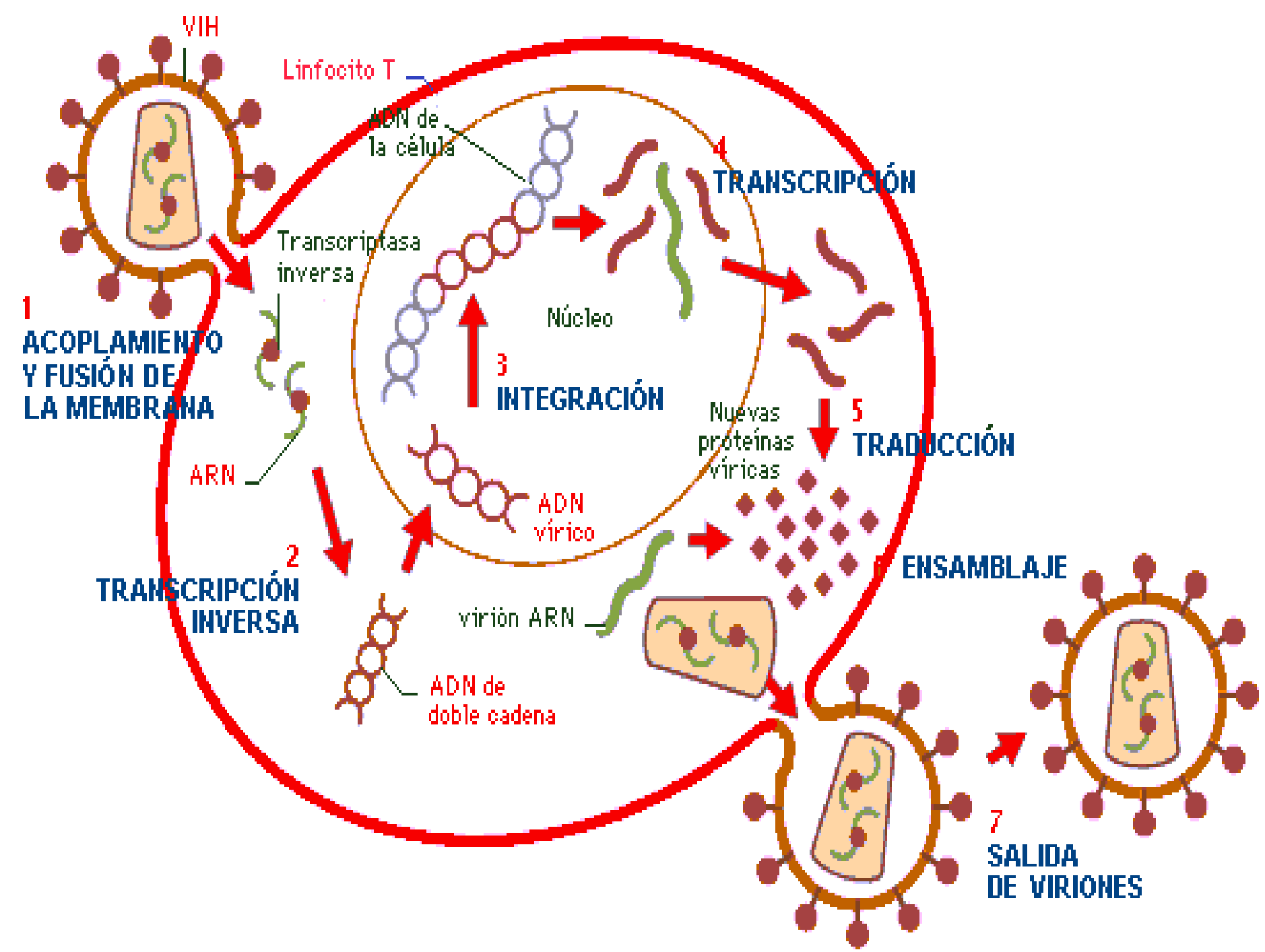
- Entre los retrovirus se conocen tres géneros:

- **oncovirus**: Virus linfotrópico de células T humanas .
- **lentivirus** : Virus de la inmunodeficiencia humana (VIH)
- **espumavirus**: Virus sincitial humano (VSH).

- Algunos oncovirus son responsables directos de algunos procesos tumorales y leucemias.
- Los retrovirus pueden ser modificados genéticamente y usados en terapia génica como vectores.



Ciclo de replicación de un retrovirus


VIH
Linfocito T
ADN de la célula
Transcriptasa inversa
1
ACOPLAMIENTO Y FUSIÓN DE LA MEMBRANA
ARN
2
TRANSCRIPCIÓN INVERSA
ADN de doble cadena
3
INTEGRACIÓN
Núcleo
ADN vírico
4
TRANSCRIPCIÓN
Nuevas proteínas víricas
5
TRADUCCIÓN
virión ARN
ENSAMBLAJE
7
SALIDA DE VIRIONES

ANTIRRETROVIRALES

- Se clasifican en:

- Inhibidores nucleósidos de la transcriptasa inversa (NRTI).
- Inhibidores no nucleósidos de la transcriptasa inversa (NNRTI).
- Inhibidores de la proteasa
- Inhibidores de la integrasa
- Antagonistas del receptor CCR5
- Inhibidores de la fusión

Inhibidores nucleósidos de la transcriptasa inversa

Son fármacos sintéticos con estructuras similares a los nucleósidos endógenos. **Inhiben la transcriptasa inversa** poniendo fin a la síntesis de la cadena viral DNA e interrumpe el ciclo de **replicación viral.**

Dentro de este grupo tenemos:

- **Zidovudina**
- **zalcitabina**
- **Abacavir**
- **Didanosina**
- **Estavudina**
- **lamivudina**

ZIDOVUDINA

Emparentado químicamente con la timidina.

- Se absorbe bien por vía oral, las comidas disminuyen la absorción.
- Fue el primer antirretroviral introducido en el mercado en el año de 1987.

- Se elimina por la orina, pasa al LCR, tiempo de vida media sérica de 1 hora.

ZIDOVUDINA

a menudo se administra en forma simultanea con lamivudina y se dispone de una presentación combinada

REACCIONES ADVERSAS:

- al comienzo del tratamiento se presentan cefaleas, nauseas, insomnio, depresión.

- Tratamientos prolongados: anemia grave, hepatotoxicidad, neurotoxicidad, decoloración de las uñas y vómito.

ZIDOVUDINA

Precauciones y contraindicaciones:

- Empeora cualquier depresión de la médula ósea.
- Se acumula en daño hepático.
- Recuentos sanguíneos periódicos.
- Riesgo/ beneficio: embarazadas

Interacciones: incrementan la toxicidad del fármaco los AINES y acetaminofen. No se recomienda usarlo simultáneamente con estavudina y ganciclovir. Interacción con los alimentos.

ZIDOVUDINA

Usos y presentación

- Fármaco de elección para tratar infecciones por VIH. La terapia debe ser asociada con otros antivirales.
- Profilaxis pos- exposición al VIH ocupacional o no, asociada con otros antirretrovirales
- Prevención de la transmisión del VIH materno-fetal.

Presentación: tab ó cap. 100, 200, 250 y 300mg; sln al 1%; jarabe 10mg/ml; amp. IV 200mg/20ml.

ABACAVIR

- Es un análogo de la guanosina.
- Tiene buena absorción oral, no se afecta con la presencia de los alimentos.
- Su vida media sérica es de 1.5 h.
- Atraviesa al LCR.
- A menudo se administra en forma simultanea con lamivudina y se dispone de una presentación combinada.

ABACAVIR

- **REACCIONES ADVERSAS:**

En las primeras 6 semanas de tratamiento se pueden presentar fiebre, malestar general, náuseas, vómito, diarrea, anorexia, tos y disnea.

PRECAUCIONES

- Evitar el alcohol
- Administrarlo con precaución en pacientes con problemas cardíacos.

La dosis recomenda en adultos es 300mg cada 12 h.

DIDANOSINA

- Es un análogo sintético de la desoxiadenosina.
- Su biodisponibilidad oral es de casi 40%.
- Atraviesa el LCR en un 20% de las concentraciones séricas.
- Tiene una excreción renal.
- El principal efecto secundario es la pancreatitis dependiente de la dosis.
- Debe usarse con precaución en pacientes con factores de riesgo cardiacos.

DIDANOSINA

- Interacciona con indinavir, atazanavir, ritonavir, itraconazol, fluoroquinolona, ganciclovir y metadona

- En su uso requiere de formulas amortiguadas para evitar la inactivación por el acido gastrico.

LAMIVUDINA

- Es un análogo de la citosina.
- Es sinérgico con diversos antirretrovirales tales como zidovudina y estavudina.
- Se utiliza contra cepas de VIH sensibles y resistentes a zidovudina.
- Tiene buena absorción oral el cual no es afectada por los alimentos.
- Tiene una vida media sérica de 2.5 h
- Atraviesa en pocas cantidades al LCR.
- Su excreción es renal.

LAMIVUDINA

- **Efectos adversos**: cefalea, mareo, insomnio, fatiga y malestar gastrointestinal.

- la biodisponibilidad aumenta cuando se administra en forma simultanea con trimetoprim – sulfametoxazol.
- No administrar conjuntamente con zalcitabina.
- Dosis en adulto: 150mg cada 12 horas.

ESTAVUDINA

- Es un análogo de la timidina.
- Tiene buena absorción oral el cual no es afectada por los alimentos.
- La vida media sérica es 1.1 h
- Atraviesa al LCR.
- Su excreción es renal.

ESTAVUDINA

- **Efectos adversos**: neuropatia sensorial periférica, pancreatitis, artralgias, acidosis láctica y debilidad muscular progresiva.

- No administrar con didanosina porque se aumentan los efectos adversos.

- No usar en combinación con zidovudina.

ZALCITABINA

- Es un análogo de la citosina.
- Tiene una biodisponibilidad oral del 87 % y una vida media sérica de 1 a 2 h.
- Requiere dosificación cada 8 horas lo que limita su utilidad.
- Interacciona con los alimentos, metoclopramida y antiácidos, disminuyendo su absorción.
- Atraviesa al LCR
- Se excreta por vía renal

ZALCITABINA

- Durante el tratamiento puede aparecer en el paciente neuropatia periférica dependiente de la dosis.
- Ulceraciones bucales y esofágicas también pueden aparecer, con menos frecuencia pancreatitis.

- No se debe usar con lamivudina, ya que esta inhibe la fosforilación de la zalcitabina disminuyendo su eficacia.

INHIBIDORES DE LA TRANSCRIPTASA INVERSA NO NUCLEÓSIDOS
NNRTI

- Se unen directamente a la transcriptasa inversa, pero en un sitio diferente a el de los NRTI.

- A diferencia de los NRTI, los NNRTI no compiten con los trifosfatos de nucleósido ni requieren fosforilación para su actividad.

- No hay resistencia cruzada entre NNRTI Y NRTI.

INHIBIDORES DE LA TRANSCRIPTASA INVERSA NO NUCLEÓSIDOS
NNRTI

- Los fármacos que hacen parte de este grupo son:

- **DELAVIRDINA**
- **EFAVIRENZ**
- **ETRAVIRINA**
- **NEVIRAPINA**

DELAVIRDINA

- Tiene una biodisponibilidad oral de casi 85%, pero disminuye por los antiácidos ó los bloqueadores H2.
- Alcanza concentraciones muy bajas en **el LCR.**
- Su vida media sérica es de 6 h.
- **Reacciones adversas**: exantemas, cefalea, nauseas, diarrea.
- No administrar en el **embarazo**: teratogenicidad
- **Interacciona con** : fosamprenavir y rifabutina, disminuyendo su eficacia.

EFAVIRENZ

- Tiene una vida media prolongada: administrar una vez al día.
- Absorción oral del 45%
- Debe tomarse con el estomago vacio.
- Se elimina por la orina y por las heces.
- Alcanza bajas concentraciones en el LCR.
- Efectos adversos: involucran al SNC: mareos, psicosis, depresión.
- Debe evitarse durante el embarazo.

ETRAVIRINA

- Tiene actividad contra la amplia variedad de VIH- 1 naturales y resistentes a NNRTI.

- Efectos adversos: exantemas, nauseas y diarrea.

- Tiene muchas interacciones farmacológicas, ej: efavirenz, lopinavir, saquinavir, itraconazol.

NEVIRAPINA

- Tiene una biodisponibilidad oral del 90% y no depende de los alimentos.
- Alcanza altas concentraciones en el LCR.
- Su vida media sérica es de 25 a 30 h.
- Se excreta por la orina
- Una sola dosis de nevirapina (200mg) es eficaz para la prevención de la transmisión de VIH de madre a recién nacido cuando se administra al inicio del parto, seguido de una dosis oral de 2mg/kg al recién nacido en los tres días siguientes.

NEVIRAPINA

- No hay datos de que sea teratogenico.
- Pueden aparecer exantemas, fiebre, nauseas, cefaleas.
- Interacciona con varios fármacos , ej: lopinavir, efavirenz, metadona, fluconazol, claritromicina, entre otras.

INHIBIDORES DE PROTEASA

- **NOS PREGUNTAMOS:**

¿ que hace la proteasa durante el ciclo vital de un virus?

¿Qué hacen los inhibidores de proteasa?

¿Cuáles son los fármacos que hacen parte de este grupo de antirretrovirales?

¿Cuáles son las características principales de estos fármacos?

Inhibidores de la entrada del virus

- **NOS PREGUNTAMOS:**

¿ cuales son los fármacos que actúan como inhibidor de la fusión entre el virus y la célula?

¿ cuales son los fármacos que bloquean la entrada del virus a la célula, inhibiendo los receptores CCR5?

¿ características principales de estos fármacos?

INHIBIDORES DE INTEGRASA

- **NOS PREGUNTAMOS:**

¿ que hace la integrasa en el ciclo vital del virus?

¿ cuales son los fármacos que bloquean esta enzima y cuales con las consecuencias de este bloqueo?

¿ características principales de estos fármacos?

DESARROLLO DE LAS PREGUNTAS

INHIBIDORES DE PROTEASA

1. la proteasa es una enzima que fragmenta las lipoproteinas inmaduras que se producen después de la traducción para producir proteínas virales maduras.

2. Los inhibidores de proteasa impiden el procesamiento de proteínas víricas, dando como resultado la producción de partículas víricas inmaduras no infectantes.

DESARROLLO DE LAS PREGUNTAS

INHIBIDORES DE PROTEASA

3. atazanavir, darunavir, fosamprenavir, indinavir, lopinavir, nelfinavir, ritonavir, saquinavir, tipranavir.

4. Las características de cada fármaco son investigadas por los estudiantes.

DESARROLLO DE LAS PREGUNTAS

Inhibidores de la entrada del virus

1. La enfuvirtida es un inhibidor de la fusión que bloquea la entrada a la célula.

2. El maraviroc se une en forma selectiva y especifica al receptor CCR5 (este es un receptor necesario para la entrada del retrovirus a la célula) ; de esta forma se bloquea la entrada del VIH a las células.
3. Las características principales de estos fármacos serán investigadas por los estudiantes.

DESARROLLO DE LAS PREGUNTAS

INHIBIDORES DE INTEGRASA

1. La integrasa es un enzima indispensable para la replicación del virus del VIH-1 y VIH-2.

2. El raltegravir es un inhibidor de la integrasa, el cual impide los últimos pasos del proceso de integración del provirus.
3. Las características principales de estos fármacos serán investigadas por los estudiantes.

MEDICAMENTOS OPIOIDES

JOHN ALMENDRA

DOLOR

Dolor: Es una sensación displacentera que alerta un daño tisular individual causado por estímulo químico, mecánico o térmico

Analgésicos : Son fármacos que alivian el dolor sin causar pérdida de la conciencia, se clasifican en :

a. Opiodes Actúan en la médula espinal y cerebro inhibiendo la neurotransmisión del dolor

b. No opioides : Actúan principalmente en la periferia inhiben la formación de impulsos del dolor por estímulos nociceptivos.

Péptidos opiodes y receptores

a) Encefalinas b) Endorfinas c) Dinorfinas

Son liberadas de las neuronas a través de las vías del dolor y bloquean la transmisión de los impulsos dolorosos

Receptores opiodes : Acoplados a proteína G su activación conduce a del ↓AMPc y ↑ de la conductancia al K+ en las neuronas afectadas

Receptores μ : median la mayoría de los efectos de los opiodes potentes

Rec. δ y κ : activados por los agonistas parciales

AGONISTAS OPIOIDES POTENTES :

I) Morfina :

Farmacocinética : Absorción TGI : buena

Metabolismo hepático de primer paso intenso → 6 glucurónido mas activo y mayor $t_{1/2}$

Farmacodinamia :

A) SNC :

a) Analgesia : Modifica el componente sensorial y afectivo

b) Euforia : Sensación de satisfacción y bienestar

Morfina Farmacodinamia ...

c) Depresión respiratoria : Causa de muerte más común en sobredosis

- ↓ la sensibilidad del CR al CO_2

d) ↓ reflejo de la tos

e) Miosis : Estimula núcleo Edinger Westphal (III par craneal). Ayuda diagnóstica

f) Emesis : Activa ZQR del área postrema

Morfina Farmacodinamia ...

B. Sistema Cardiovascular →

Vasodilatación por liberación de histamina , hipotensión ortostática

En enfermedad coronaria ↓ la RP → ↓ trabajo cardiaco y consumo de oxígeno

C. TGI , Biliar y Genitourinario

a) ↑el tono TGI , ↓ peristaltismo → Estreñimiento

Morfina- Farmacodinamia

c)↑el tono del esfínter vesical → retención urinaria

d) Dosis terapéuticas : prolongan el parto

D. E. Neuroendocrinos e inmunológicos

a) Estimulan liberación de HAD, Prolactina

b) Inhiben la liberación de HL

c) Suprimen la actividad de linfocitos (células NK)

E. Tolerancia y dependencia física

No se desarrolla tolerancia a miosis ni estreñimiento

Morfina : Indicaciones Terapéuticas

Dolor severo asociado con trauma , I.M., cáncer

II Fentanilo :

Más potente que morfina . Se presenta para aplicación transdérmica para dolor severo y adyuvante de la anestesia general.

III. Meperidina :

Efectos similares a morfina, menos potente y eficaz , puede provocar midriasis

No prolonga el parto . Usada en analgesia obstétrica, postquirúrgica . Dolor moderado.

IV. Metadona

Larga duración usada oralmente en programas de adictos a opiodes

AGONISTAS OPIODES MODERADOS

I . Codeína

+ Convertida a morfina por CYP2d6. Usualmente administrada en combinación con no opiodes para dolor leve a moderado

+ Gran efecto antitusivo .

II. Propoxifeno : usado con acetaminofén para dolor somático y visceral moderado .

III. OTROS AGONISTAS OPIOIDES

TRAMADOL :

Se absorbe oralmente.

***Analgésico de doble acción :**

***Activa receptores mu e inhibe recaptación de serotonina y noradrenalina sobre la transmisión del dolor en la médula espinal**

***Util en dolor moderado , eficaz en síndromes dolorosos crónico con mímima depresión respiratoria y cardiovascular . Obstetricia**

***Disminuye el umbral convulsivo**

IV . AGONISTAS - ANTAGONISTAS

Pentazocina, butorfanol

Son agonistas parciales o antagonistas en receptor mu , agonista o antagonista en Kappa

Farmacocinética : todos administración parenteral

Pentazocina disponible para vía oral

Efectos adversos : ansiedad, pesadillas ,efectos psicotomiméticos , síndrome de abstinencia en personas dependientes a los agonistas totales

Usos clínicos : analgesia preoperatoria , obstétrica

V. ANTAGONISTAS OPIODES :

Alta afinidad por el receptor opioide

Sin efecto en sujetos normales , pero revierten rápidamente el efecto de agonistas y producen síndrome de abstinencia

a) Naloxona : usada para revertir el coma y depresión respiratoria de sobredosis de opiáceos ; efectos i.v 30”

b) Naltrexona Mayor duración

Utilizada en programas de dependencia a opiodes y alcohol

Selectividad de los opioides sobre receptores

	subtipo de receptor		
Agente	Mu	Delta	Kappa
Encefalinas	Ag ++	Ago+++	-----
Fentanilo	**Ag.+++**		
Metadona	**Ag. +++**		
Morfina	Ag. +++		Ag+
Pentazocina	Ag.P		Ag++
Naloxona, Naltrex.	**Ant.**	**Ant.**	**Ant.**