

**INSTITUTO SUPERIOR TECNOLÓGICO
ISABEL LA CATÓLICA**

Antieméticos

DOCENTE: Mg. Mely Ruiz Aquino

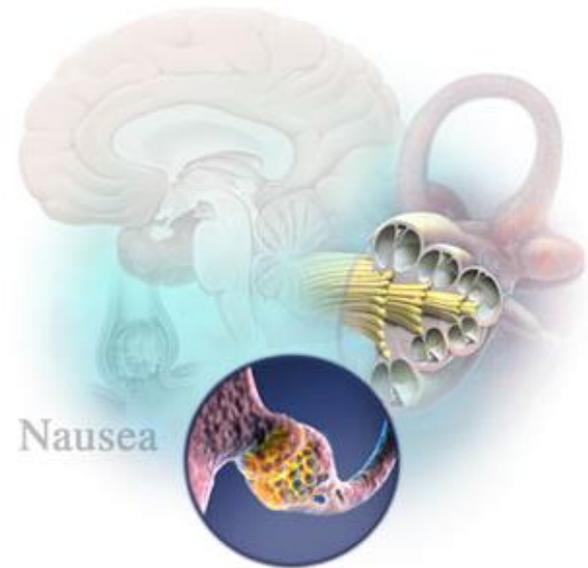


VÓMITO o EMESIS

- Expulsión rápida y forzada del contenido gástrico a través de la boca; es un reflejo neuromuscular
- Suele estar precedido de náusea; la cual es una sensación subjetiva

Se puede generar vómito también por:

- Sistemas de equilibrio en el oído (mareo).
- Percepciones del cerebro → Vista, olores o pensamientos alterados.



Respuesta común a gran variedad de estímulos y circunstancias fisiológicas.

Etiología (causa):

A. Origen en SNC.

- Funcionales → Miedo, estrés, depresión.
- Orgánicos → Hipertensión intracraneana.

B. Tóxico.

Estimulación del centro del vómito o irritación de mucosa gástrica.

Fármacos (digitales, AINE, antibióticos), trastornos metabólicos (síndrome urémico, cetoacidosis diabética).

C. Viscerales.

Enfermedades orgánicas del tracto digestivo.

D. Metabólicos y nutricionales.

Exceso o disminución de vitaminas, desnutrición, hipotiroidismo e insuficiencia suprarrenal.

E. Vértigo postural.

Compromiso de la función vestibular.



FISIOPATOLOGÍA DEL VOMITO

El vómito es un proceso complejo que consta de varias fases:

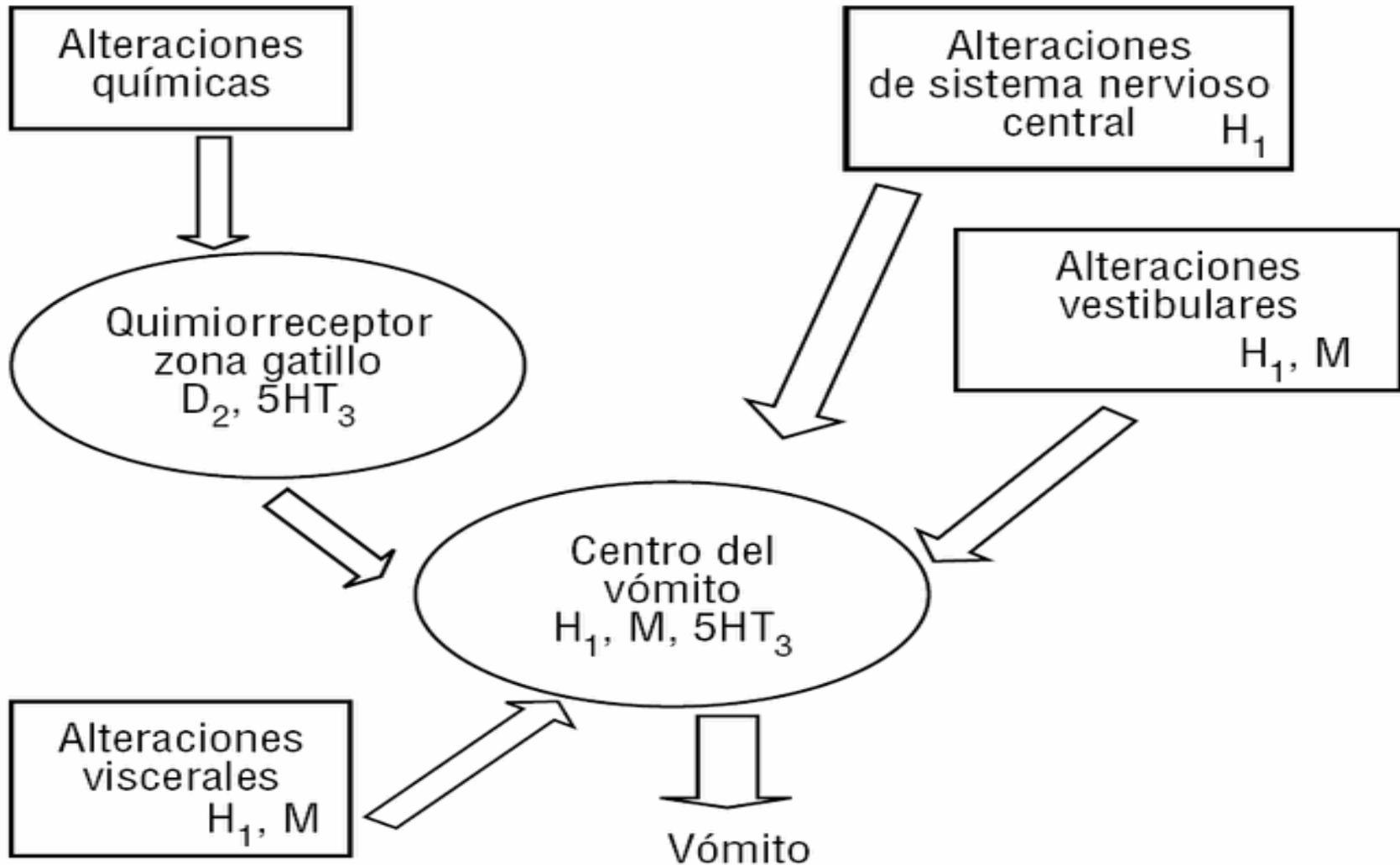
- **Pre-expulsión**
(relajación gástrica y retroperistaltismo)
- **Arqueo**
(contracción de los músculos abdominales e intercostales y del diafragma, glotis cerrada)
- **Expulsión**
(contracción intensa de los músculos abdominales y relajación del esfínter esofágico superior".



En la producción final del vómito están implicados diferentes neurotransmisores: dopamina. serotonina. acetilcolina e histamina. Los antieméticos actúan bloqueando los receptores de estos neurotransmisores.



FISIOPATOLOGÍA DEL VOMITO



FÁRMACOS ANTIEMÉTICOS:

- **ANTAGONISTAS H1**
 - **ANTAGONISTAS MUSCARÍNICOS**
 - **ANTAGONISTAS DOPAMINÉRGICOS D2**
 - **ANTAGONISTAS 5HT3**
 - **ANTAGONISTAS NK1**
 - **OTROS**
 - Corticoides
 - Cannabinoides sintéticos
- VÓMITOS
ORIGEN LABERINTICO

1. ANTAGONISTAS DOPAMINÉRGICOS D2

- **Metoclopramida**
- Domperidona
- Neurolepticos:
 - Fenotiacinas
 - Haloperidol

1.1. METOCLOPRAMIDA (primperan)

- Inhibe Dopaminoceptores D2
- Inhibe los 5HT-3 (a altas concentraciones)

■ Indicaciones:

- Postoperatorio
- Procesos digestivos agudos
- Asociados a migraña
- Fármacos no citotóxicos
- A DOSIS ELEVADAS: Vómitos secundarios a citostáticos

□ Efectos secundarios: trastornos del movimiento, astenia, sedación, diarrea, aumento de la Prolactina

METOCLOPRAMIDA (PRIMPERAN)

FARMACOCINETICA:

- Buena absorción digestiva por vía oral o rectal así también IV, IM.
- Metabolización a nivel hepático por un proceso de glucuronoconjugación.
- Atraviesa la barrera hematoencefalica.
- vida media: 2 a 4 hrs. administración cada 6 a 8hrs
- IV rápida provoca excitación del SNC por antagonismo con la dopamina.



Acción terapéutica:	En ads.: prevención de náuseas y vómitos postoperatorios (NVPO), inducidos por radioterapia (NVIR) o retardados inducidos por quimioterapia (NVIQ) y tto. sintomático de náuseas y vómitos incluyendo los inducidos por migraña aguda; en niños y adolescentes de 1-18 años: como segunda línea de tto. en prevención de náuseas y vómitos
Dosis:	Ads.: 10 mg hasta 3 veces/día. Niños: 0,1-0,15 mg/kg de p.c. hasta 3 veces/día. Duración máx. del tto. 5 días. Dosis máx. 0,5 mg/kg/día. I.R. o I.H. graves disminuir dosis.
Vía de administración:	V.O. EV
Efectos adversos:	Somnolencia, diarrea, astenia, trastornos extrapiramidales (al exceder la dosis recomendada), parkinsonismo, acatisia, depresión, hipotensión, aumento transitorio de la presión arterial.
Forma de presentación:	Comprimidos por 10 mg. Iny 10mg/2ml
Contraindicaciones e interacciones mas frecuentes:	Hipersensibilidad. Hemorragia gastrointestinal, obstrucción mecánica o perforación gastrointestinal. Antecedente de discinesia tardía por neurolépticos o metoclopramida. Feocromocitoma. Epilepsia. Parkinson. Combinación con levodopa o agonistas dopaminérgicos. Antecedente de metahemoglobinemia con metoclopramida o deficiencia en NADH citocromo b5 reductasa. Niños < 1 año por aumento del riesgo de reacciones extrapiramidales. Véase Contraindicaciones Además: Antagonismo mutuo con: anticolinérgicos y derivados de morfina. Efecto sedante potenciado por: alcohol, derivados de morfina, ansiolíticos, antihistamínicos H ₁ sedantes, antidepresivos sedantes, barbitúricos, clonidina y relacionados

METOCLOPRAMIDA (PRIMPERAN)



METOCLOPRAMIDA (PRIMPERAN)

ACCIÓN GASTROCINETICA:

- Aumentan las contracciones peristálticas del estómago y duodeno mientras que aumentan el tono del esfínter esofágico (el cardias se contrae), por lo tanto se impide el reflujo de alimento.
 - relajación del píloro.
 - Activan el peristaltismo del duodeno, permitiendo un mejor procesamiento enzimático.
 - No tienen efecto sobre la secreción gástrica ni intestinal.
 - Controvertida la posible acción sobre colon.
 - **Dosis:** metoclopramida: (0.2-0.4 mg/Kg. SC, IM, V/O o 1 mg/Kg./24 hrs. IV en infusión continua).
- 

2. ANTAGONISTAS H1 **DIMENHIDRINATO**

1.1. DIMENHIDRINATO (Gravol)

FARMACOCINETICA:

- Vía Oral, parenteral
- Metabolismo Hígado
- Vida media 1-4 horas
- Excreción Renal

ACCIONES FARMACOLÓGICAS:

- Efectos depresores sobre el sistema nervioso central
- Inhiben la estimulación vestibular y del laberinto que se produce en los viajes y en el vértigo (efectos anticolinérgicos)



DIMENHIDRINATO (GRAVOL)

APLICACIONES TERAPÉUTICAS:

- Prevenir las náuseas, vómitos y mareos causados por viajes (Cinetosis)

TOXICIDAD:

- Convulsiones
- Coma
- Depresión respiratoria

Dosis: 1.25 mg/kg 6-8 horas

Presentación: Tab 50 mg. Amp. 50 mg/5ml



Dosis:	Oral, ads.: 47,25-100 mg/3-8 h, máx. 400 mg/día; niños 2-6 años: 12,5-25 mg/6-8 h, máx. 75 mg/día; niños 7-12 años: 25-50 mg/6-8 h, máx. 150 mg/día. Chicles (20 mg): ads. y niños > 6 años, mascar 1 chicle, repetible a las 1-3 h. Rectal, ads.: 100 mg/3-4 h; niños 7-12 años: 50 mg/3-4 h; niños 2-6 años: 25 mg/3-4 h. Cinetosis: administrar la 1ª dosis 30 min antes de comenzar el viaje (preferiblemente 1 ó 2 h antes). Dejar 6 h entre cada toma como mín.
Vía de administración:	V.O. EV
Efectos adversos:	Taquicardia, palpitaciones, otras arritmias cardiacas; somnolencia, sedación, cefalea, vértigo, mareo; glaucoma, trastornos de la visión (midriasis, visión borrosa, diplopía); aumento de la viscosidad de secreciones bronquiales; náuseas, vómitos, estreñimiento, diarrea, dolor epigástrico, anorexia, sequedad de boca; retención urinaria, impotencia sexual; reacciones de hipersensibilidad y fotosensibilidad; ataques agudos de porfiria; hipotensión, HTA.
Forma de presentación:	Tab 50 mg. Amp. 50 mg/5ml
Contraindicaciones e interacciones mas frecuentes:	<p>Hipersensibilidad al dimenhidrinato o difenhidramina; recién nacidos y prematuros; crisis asmáticas; porfiria.</p> <p>Aumenta efectos de: depresores del SNC (barbitúricos, alcohol, anestésicos, etc.).</p> <p>Efectos anticolinérgicos aumentados con: antidepresivos tricíclicos, neurolépticos, antiparkinsonianos, IMAO, etc., riesgo de íleo paralítico.</p> <p>Potencia efecto fotosensibilizador de otros fármacos.</p> <p>Lab: falso- de pruebas cutáneas con alérgenos (suspender tto. 72 h antes).</p>

Prototipo de los antieméticos antagonistas de serotonina.

FARMACODINAMIA

No se conoce.

Antagonista de la serotonina selectivo de receptores 5 – HT3 (subtipo de los receptores de serotonina).

La quimioterapia y la radioterapia favorecen la liberación de serotonina.

FARMACOCINÉTICA

Vía oral e IV.

Se une a proteínas plasmáticas en 70 – 80%.

Vida media:6 – 8 h.

Se metaboliza en hígado.

Eliminado en orina y heces.



ONDANSETRÓN

INDICACIÓN

- Náuseas y vómito asociados con quimioterapia y radioterapia.
- Náuseas y vómito posoperatorios.
- Náuseas y vómito que no responden a otros antieméticos.

DOSIS

1 tableta, 2 – 3 veces al día.

2 ampolletas por vía IV 2 veces al día.

PRESENTACIÓN

- Tabletas (4 – 8 mg).
- Ampolletas (4 – 8 mg).



Vía de administración:	V.O.
Efectos adversos:	Cefalea, estreñimiento, sensación de calor o rubor, sofocos, estreñimiento, reacción local en lugar de iny. IV.
Forma de presentación:	Comp recub. 4mg
Contraindicaciones e interacciones mas frecuentes:	<p>Hipersensibilidad al principio activo u otros antagonistas 5-HT₃ . Uso concomitante con apomorfina.</p> <p>Concentraciones plasmáticas reducidas por: inductores del CYP3A4 (fenitoína, carbamazepina, rifampicina).</p> <p>Puede reducir efecto analgésico de: tramadol (pequeños estudios).</p> <p>Prolongación adicional intervalo QT con: fármacos prolongadores QT.</p> <p>Mayor riesgo de arritmias con: fármacos cardiotoxicos (p. ej. antraciclinas).</p>



RECOMENDACIONES

- Administrarse por vial oral después de los alimentos
- Administrar lento y diluido
(30-60 minutos)
- Vigilar sistema nervioso central y efectos adversos



Antieméticos



<https://www.youtube.com/watch?v=YaA-NjUvuE>



GRACIAS

