7 ANTICOLINÉRGICOS

JESÚS RUIZ DE LAS HERAS

NIVEL I

INTRODUCCIÓN

Cuando hablamos de anticolinérgicos nos referimos a los fármacos que bloquean los receptores de la acetilcolina de tipo muscarínico (hay 3 tipos de receptores muscarínicos: M1 o neuronales, M2 o cardíacos y M3 o glandulares), a diferencia de los no despolarizantes que bloquean los de tipo nicotínico, luego nuestros anticolinérgicos en realidad son antimuscarínicos.

Los anticolinérgicos bloquean de manera competitiva el efecto de la acetilcolina uniéndose por un enlace tipo ester al receptor de acetilcolina, impidiendo que este se active, que se generen segundos mensajeros como el GMPc (su inhibición parece que permitiría tratar las reacciones de hipersensibilidad aunque no parece ser un tratamiento eficaz) produciendo los siguientes efectos sobre los distintos órganos:

a) **Cerebral**

Según el tipo y dosis de anticolinérgico pueden producir efectos estimulantes como excitación o alucinaciones o pueden producir efectos depresivos del sistema nervioso central como amnesia y sedación.

b) **Temperatura**

Grandes dosis de anticolinérgicos pueden inhibir la función de las glándulas sudoríparas aumentando la temperatura (fiebre atropínica). También dosis grandes pueden dilatar vasos cutáneos produciendo un cuadro de bochorno atropínico.

EDAIC 2007

En relación con el tratamiento con medicación anticolinérgica

la premedicación con atropina debe evitarse en niños con fiebre ✓✓

c) **Oftálmico**

Midriasis y cicloplejia. Posible aunque no probable el glaucoma de ángulo cerrado.

EDAIC 2007

Los efectos de la atropina instilada en el ojo normal incluyen

aumento de la presión intraocular ✓

enoftalmos ✓

d) **Respiratorio**

Relajación del músculo liso bronquial, aún más evidente en EPOC y asmáticos; y disminución de secreciones respiratorias.

e) **Cardiovascular**

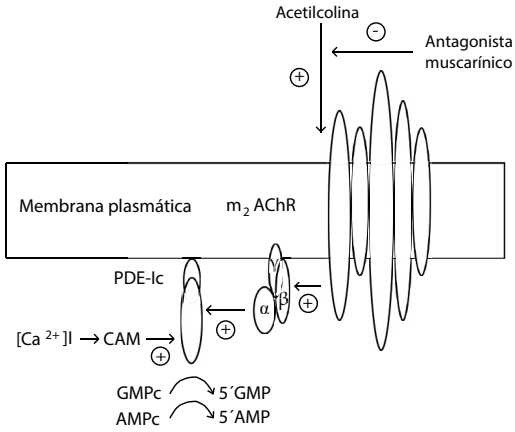
Aumento de la frecuencia cardíaca. Existe un efecto paradójico en el que dosis bajas de anticolinérgicos pueden disminuir la frecuencia cardíaca en posible relación con un efecto agonista parcial de los mismos. Acelera el paso del impulso por el nodo auriculoventricular disminuyendo el PR y con ello la posibilidad de bloqueo AV de causa vagal, pueden desencadenar arritmias auriculares y ritmos nodales, poco efecto en ventrículo y vasculatura.

f) **Gastrointestinal**

Disminuye la motilidad gastrointestinal, incluida la contracción del esfínter esofágico inferior, y sus secreciones.

g) **Genitourinario**

Retención urinaria.



ATROPINA

Características

Amina terciaria formada por ácido trópico y tropina, antagonista competitivo de receptores muscarínicos periféricos y centrales, liposoluble capaz de atravesar la barrera hematoencefálica.

Posología

En premedicación y bradicardia sinusal: 0,01-0,015 mg/kg iv. (dosis mayores en niños que en adultos).

En broncoespasmo: bromuro de ipatropio (derivado de la atropina) 0,025 mg/kg inh. cada 6 h.

Intoxicación por organofosforados: 1-2 mg iv. a repetir en 10-15 min si se precisa.

Farmacocinética

a) **Absorción:** vías iv., im., sc., traqueal. Por vía iv. su efecto empieza en 1 min y dura 30-40 min.

b) **Metabolismo:** hepático en más del 50%.

c) **Eliminación:** renal, muy poca actividad se excreta intacta.

Efectos

a) **Neurológicos:** sedación, coma, amnesia, hipertermia.

b) **Oculares:** midriasis y ciclopejia (valorar en el glaucoma de ángulo cerrado). Puede producir fotofobia.

EDAIC 2007

Los efectos de la atropina instilada en el ojo normal incluyen

parálisis del esfinter del músculo de la pupila ✓✓

parálisis del músculo ciliar ✓✓

fotofobia ✓✓

c) **Respiratorios:** broncodilatación.

EDAIC 2007

En relación con el tratamiento con medicación anticolinérgica

la atropina aumenta el espacio muerto ✓✓

d) **Cardiovasculares:** aumento de la frecuencia cardíaca pudiendo dar disociación AV y arritmias.

EDAIC 2007

En relación con el tratamiento con medicación anticolinérgica

1.0 mg de atropina produce un bloqueo vagal completo en un hombre de 70 Kg ✓

e) **Gastrointestinal:** disminución de la motilidad gastrointestinal, de la contracción del esfínter esofágico inferior y de secreciones. Aún más evidentes sus efectos antisialogogos en combinación con fármacos con acción anticolinérgica como antidepresivos tricícli-

cos, antihistamínicos, antiparkinsonianos y antipsicóticos.

EDAIC 2007

Fármacos conocidos que aumentan la presión barrera en la unión gastroesofágica incluyen

atropina ✓

f) **Genitourinario:** retención urinaria (valorar en HBP).

GLUCOPIRROLATO

Características

Amonio cuaternario con ácido mandélico en vez de ácido trópico que le impide pasar la barrera hematoencefálica, tampoco tiene actividad oftálmica. Tiene una duración mayor que la de la atropina.

EDAIC 2007

En relación con el tratamiento con medicación anticolinérgica

la acción del glicopirrolato dura más que la de la atropina ✓✓

Posología

a) En premedicación: 0,005 a 0,01 mg/kg iv. (mitad quela atropina).

b) En broncoespasmo: 0,4- 0,8 mg inh. cada 8 horas.

Farmacocinética

a) **Absorción:** vías iv., im., sc., vo., inh. Por vía iv. su efecto empieza en 1 min y dura 2-4 h.

b) **Metabolismo:** hepático.

c) **Excreción:** renal.

Efectos

a) **Neurológicos**

Casi sin efectos sobre el SNC aunque se ha descrito hipertermia y cierto grado de confusión mental sobre todo en ancianos y en dosis suficientes podría producir síndrome anticolinérgico central (tratado con fisostigmina).

b) **Oculares**

Pocos, cierto efecto midriático y cicloplejico, menos que otros anticolinérgicos.

c) **Respiratorios**

Broncodilatación y disminución de las secreciones respiratorias.

d) **Cardiovasculares**

Aumento de la frecuencia cardíaca (no suele hacerlo cuando la administración es im.), arritmias (también FV), disociación AV, efecto paradójico bradicardizante a dosis bajas.

e) **Gastrointestinales**

Disminución de motilidad y secreciones gastrointestinales.

f) **Genitourinarios**

Retención urinaria.

ESCOPOLAMINA

Características

Tiene la misma estructura que la atropina más un puente de O_2 convirtiendo la tropina en escopina. Se la conoce con nombres como buscapina o hioscina.

Posología

En premedicación: 0,01-0,015 mg/kg iv. (igual que la atropina).

Farmacocinética

a) **Absorción:** vías iv., im. (usada en premedicación), vo., rectal.

b) **Metabolismo y excreción:** renal.

Efectos

a) **Neurológicos:** efectos anticolinérgicos potencialmente mayores que los de atropina.

b) **Oftálmico:** midriasis y cicloplejia.

c) **Respiratorio:** pocos efectos, raramente disnea.

d) **Gastrointestinal:** antisialogogo más potente que atropina, principal efecto por el que se utiliza. Aún más evidentes sus efectos antisialogogos en combinación con fármacos con acción anticolinérgica como antidepresivos tricíclicos, antihistamínicos. Junto con dopamina puede disminuir el efecto de ambas drogas sobre el tracto gastrointestinal. Alteración de la motilidad intestinal.

e) **Genitourinario:** retención urinaria. Espasmolítico de corta duración de acción.

EDAIC 2007

En relación con el tratamiento con medicación anticolinérgica

la premedicación con hioscina (escopolamina) debe ser evitada en pacientes viejos ✓✓

f) **Alergia:** reacciones de anafilaxia descritas.

EDAIC 2013

Los efectos secundarios extrapiramidales pueden ser por:

escopolamina ✓