

ESTIMULANTES

AMINAS SIMPATICOMIMÉTICAS

DEFINICIÓN

El término de aminas simpaticomiméticas se emplea para calificar a las sustancias cuyos efectos resultan muy similares a los que se producen por la estimulación de las fibras adrenérgicas posganglionares. Estructuralmente estas sustancias están formadas por un anillo benzénico, que constituye la porción aromática de la molécula, y una cadena alifática, la etilamina. Esta estructura permite numerosas sustituciones en el anillo aromático, en los carbonos alfa y beta de la cadena lateral y en el nitrógeno terminal, lo que da origen a una gran variedad de compuestos con actividad simpaticomimética.

CLASIFICACION

Estas sustancias suelen agruparse en catecolaminas (si tienen grupos hidroxilo en la posición 3 y 4 del anillo aromático) y no catecolaminas (si carecen de estos grupos). Empero, aquí sólo se incluye información acerca de las anfetaminas, sustancias pertenecientes al segundo grupo, que tiene como característica fundamental inducir alteraciones profundas en el Sistema Nervioso Central y provocar farmacodependencia.

ACCIÓN FARMACOLÓGICA

Los efectos más importantes de las anfetaminas se producen en el Sistema Nervioso Central, el sistema cardiovascular y el músculo liso, si bien los del orden psíquico dependen de las dosis, así como del estado mental y la personalidad del sujeto. Los efectos más notorios se generan con dosis de 10 a 30 miligramos; estos son, aumento del estado de alerta y de la iniciativa, falta de sueño, disminución de la sensación de fatiga, mejoría del talento y la confianza, y habilidad para concentrarse, euforia y verborrea. Mejora la capacidad mental para resolver problemas sencillos, aunque no disminuyen necesariamente el número de errores en problemas específicos. También se incrementa la capacidad física, aun cuando este efecto es variable y dosis más elevadas o repetidas pueden provocar reacciones opuestas, depresión y fatiga.

Este tipo de fármacos produce aumento de la actividad espontánea, intranquilidad, agitación, estimulación del centro respiratorio, merma en el apetito y pérdida del peso corporal. y no es raro que algunas aminas simpaticomiméticas lleguen a desarrollar efectos analgésicos y activen esta propiedad en determinados narcóticos. En general, aceleran y desincronizan el electroencefalograma; aumentan la incidencia de ondas de alta frecuencia y reducen la amplitud y duración de las ondas delta que se presentan después de un periodo prolongado de insomnio.

Por otra parte, las anfetaminas incrementan la presión arterial sistólica y diastólica, generan constricción de los vasos sanguíneos-excepto de las coronarias-, relajación del músculo liso de los bronquios, del estómago, el intestino, la vejiga, y el uréter; asimismo, contracción de los esfínteres y de la cápsula esplénica. La respuesta del útero es variable, aunque comúnmente corresponde a un aumento del tono muscular. Ahora bien, la mayor parte de las acciones periféricas de las anfetaminas se atribuyen a la liberación de catecolaminas. Y es un hecho que inducen dependencia psíquica y física, y que la suspensión de su suministro provoca molestias importantes e intensas.

FARMACOCINÉTICA

Las anfetaminas se absorben bien a través del tracto gastrointestinal y se distribuyen rápidamente por todos los tejidos y líquidos orgánicos, alcanzando elevadas concentraciones en el cerebro y en el líquido cefalorraquídeo. Y aun cuando la biotransformación de estas sustancias en el hombre es poco conocida, se sabe que en los animales las moléculas desmetilan, se hidrozilan, se desaminan y/o se conjugan en el hígado. Se ha logrado descubrir incluso que, en el hombre, gran parte de las fenilisopropilamina se eliminan a través de la orina sin manifestar cambios, aunque la administración de cloruro de amonio activa significativamente la eliminación urinaria de anfetamina debido a la acidificación.

USOS CLÍNICOS

Las anfetaminas se pueden utilizar en el tratamiento de:

- a) La narcolepsia
- b) La disfunción cerebral mínima en los niños, especialmente en el síndrome hiperkinético.
- c) La obesidad endógena (aunque su uso para estos fines no sea recomendable)
- d) Los síndromes depresivos endógenos, como coadyuvante de la terapia psicofarmacológica antidepresiva.

POSOLOGÍA

Los sulfatos de anfetamina y dextroanfetamina se administran en dosis de cinco a diez miligramos, una por la mañana y otra al mediodía, con un máximo de 20 miligramos para una dosis simple y no más de 40 miligramos en 24 horas.

El clorhidrato de metanfetamina, se administra en forma oral, en dosis de 2.5 a 10 miligramos; y por vía intramuscular o intravenosa, en dosis de 10 a 30 miligramos.

SIGNOS Y SÍNTOMAS DE INTOXICACIÓN AGUDA.

Excitabilidad, escalofrío, irritabilidad, agresividad, insomnio, fiebre, euforia, hipertensión, resequedad bucal, "sabor metálico", anorexia, náuseas, reflejos hiperactivos, libido incrementada, inquietud, temblores, vértigo, confusión, arritmias cardíacas, dolor anginoso, colapso circulatorio, vómitos, diarrea, dolor abdominal, rubicundez, midriasis, pulso rápido al principio y luego lento y débil, espasmos musculares, alucinaciones, delirio, convulsiones, coma y falla respiratoria.

TRATAMIENTO

1. Respiración artificial y oxígeno en caso de ser necesario.
2. Dar leche, agua o carbón activado (50 miligramos en 500 mililitros de agua) para demorar la absorción.
3. Provocar el vómito en pacientes conscientes pero cuidando que no haya broncoaspiración.
4. Efectuar lavado gástrico y suministrar enseguida 30 gramos de sulfato de sodio en 250 mililitros de agua.
5. Controlar las convulsiones mediante la administración cuidadosa de éter en goteo abierto.
6. Sedar con clorpromazina (0.5 a 4 mg/kg de peso corporal), o diazepam parental. Se usan pequeñas dosis cuando la droga ha sido ingerida en combinación con barbitúricos.
7. Tratar el shock convencionalmente.
8. La sed puede ser intensa, pero se debe limitar la ingestión de agua debido al riesgo de edema pulmonar.
9. Vigilar el balance de fluidos y electrolitos.
10. Para la reacción sistémica, administrar levomepromazina 25 mg IM o haloperidol cinco mg, cada ocho o 12 horas.
11. Es recomendable, en casos severos de hipertensión, la diálisis extracorpórea.
12. Son buenos los baños de esponja y la aplicación de compresas de hielo para controlar la fiebre.
13. Hay que mantener al paciente quieto y en una habitación oscura.
14. Para la protección del paciente, que puede autodañarse, deben usarse camas con cintas de sujeción acojinadas.

COCAÍNA

ACCIÓN FARMACOLÓGICA

Es un anestésico local tipo éter. por su peligrosidad, ya que causa dependencia, su uso está restringido actualmente a cirugía oftálmica y de oído, nariz y garganta. Sus efectos anestésicos, cuando se aplica a mucosas, comienzan entre los cinco y seis minutos y persisten durante 20 o más, según la concentración de la sustancia y la

vascularidad del tejido. En el ojo, la cocaína, provoca blanqueamiento de la esclerótica, dilatación de la pupila y efectos anestésicos en las estructuras superficiales. Sin embargo, la primera aplicación puede causar dolor y aumentar la midriasis por la adicción de atropina u homatropina.

Sistémicamente, la cocaína estimula la corteza cerebral y crea un sentimiento de bienestar; cesa la fatiga y aumenta la capacidad de trabajo. Nunca se debe administrar una solución de cocaína por inyección en anestesia local regional o espinal; hay otros anestésicos igual de efectivos y más seguros.

FARMACOCINÉTICA

La cocaína se absorbe lentamente debido a la vasoconstricción que provoca y es probable que una mínima parte (del uno al nueve por ciento) se excrete sin cambio en la orina, si bien entre el 35 y el 55 por ciento de elimina como benzoilectonina.

USOS CLÍNICOS

Se emplea como anestésico en cirugía oftálmica y otorrinolaringológica.

POSOLOGÍA

Vía de administración local; se usa una solución que contenga del dos al cuatro por ciento de cocaína para dilatar la pupila. Para la nariz, las soluciones deben contener de cinco a diez por ciento de dicha sustancia.

SIGNOS Y SÍNTOMAS DE INTOXICACION AGUDA

Inquietud, excitabilidad, euforia, alucinaciones, resequedad bucal, midriasis, incremento de los reflejos, escalofrío, fiebre, dolor abdominal, náuseas, vómito espasmos musculares, pulso rápido al principio y luego lento y débil, palidez, respiración irregular y rápida que después se torna baja y lenta, convulsiones de origen cerebral, hipertensión, fallas circulatorias, comas y colapso respiratorio.

TRATAMIENTO

- 1.- Dar agua, leche o carbón activado (50 gramos en 500 mililitros de agua para inducir vómito) cuando se haya usado por vía oral, lo cual no es frecuente.
- 2.- Remover la droga por lavado gástrico con una solución de permanganato de potasio 1:200. Después, dejar un catártico salino en el estómago (30 gramos de sulfato de sodio en 250 mililitros de agua).
- 3.- Si la cocaína fue aplicada sobre las mucosas, será necesario lavar éstas con agua o una solución salina normal.

4.- En cambio, si fue inyectada, retardar su absorción mediante torniquete y compresas de hielo en el sitio de la aplicación.

5.- En caso de convulsiones, administrar tiopental sódico al 2.5 por ciento por vía intravenosa, lentamente, o un goteo abierto de éter con registro de minuto a minuto. También se puede usar un barbitúrico de corta acción, o diazepam 20 miligramos en 500 mililitros de suero fisiológico.

6.- Si hubiese dificultad en la respiración, proporcionarla en forma artificial o administrar oxígeno, según sea necesario. Si las convulsiones interfieren con la respiración, se puede aplicar succinilcolina (10 a 50 miligramos) por vía intravenosa, pero sin interrumpir la respiración artificial.

7.- Las medidas de cuidado más adecuadas para el paciente son mantenerlo caliente aplicando calor externo, si bien las compresas de hielo en la cabeza, la quietud y el uso de cinturones de sujeción acolchados para prevenir posibles lesiones, forman parte esencial de ellas.

DERIVADOS DE LA COCAÍNA

Recientemente se han introducido para su uso fumado las formas de cocaína en pasta, base libre y cristal. En este último, conocido como crack, hay un lapso más breve entre el momento de consumirlo y el inicio de los efectos, que en las formas inhalada e intravenosa va de los cinco a los seis minutos, mientras que con el crack tarda sólo de ocho a diez segundos.

El pico de los efectos, en el caso de la cocaína inhalada o intravenosa, no va más allá de los 45 minutos y su vida media plasmática es de 90 minutos. En tanto, con el crack son sólo de ocho a diez minutos, lo que contribuye a que el farmacodependiente repita de manera constante su uso y en consecuencia tenga un mayor potencial adictivo.

Particular atención merece la intoxicación aguda por crack, dado que las posibles repercusiones sistemáticas derivadas de su empleo pueden llevar a la muerte al usuario. Son cuatro los sistemas más afectados:

Respiratorio: las repercusiones van desde el aumento en el ritmo respiratorio y superficialidad del mismo, hasta complicaciones graves como edema pulmonar, paro respiratorio y neumotorax.

Cardiovascular: a los incrementos en el ritmo cardíaco y la tensión arterial, se pueden agregar arritmias ventriculares, isquemia miocárdica y hasta infarto agudo del miocardio.

Nervioso Central: se asocia con alteraciones vasculares cerebrales que pueden llevar a ictus cerebrales no ligados con malformaciones vasculares y otras patologías similares preexistentes.

Urinario: puede llevar a necrosis tubulares agudas.

TRATAMIENTO

- 1.- Si la droga fue inhalada, remover la que pueda quedar mediante lavado con agua o solución salina de las mucosas.
- 2.- Mantener la actividad respiratoria, de ser necesario mediante intubación endotraqueal o cualquier otro tipo de ventilación asistida.
- 3.- Restablecer el equilibrio ácido-base mediante soluciones de bicarbonato o lactato, preferentemente monitorizando gases y pH sanguíneos.
- 4.- Efectuar electrocardiograma para el manejo inmediato de arritmias cardíacas. En este caso se recomienda fenitoina o difenilhidantoina, 100 miligramos intravenosos hasta por cada cinco minutos, mientras prevalezcan las arritmias o hasta un máximo de un gramo con dosis de mantenimiento pro vía oral, de 400 a 600 miligramos cada 24 horas.
- 5.- En caso de convulsiones se recomienda diazepam o clonazepan en dosis convencionales.
- 6.- En caso de fiebre se recomiendan medios físicos para su control, procurando evitar la vasoconstricción brusca.
- 7.- La hipertensión arterial severa de be ser tratada mediante vasodilatadores, betabloqueadores, antagonistas del calcio, según la disponibilidad de los que se consideran medicamentos de elección. Se sugiere la nitroferriicianida sódica, de medio a un microgramo por kologramo y por minuto, intravenosa lenta. Otra alternativa es la fetolamina, de uno a dos miligramos por minuto. De los betabloqueadores se recomienda el labetalol, 200 miligramos intravenosos diluídos en 200 mililitros de solución glucosada al cinco por ciento y de cloruro de sodio al nueve por ciento: de uno a dos miligramos por kilógramo de peso. Ente los antagonistas del calcio, la nifedipina sublingual, diez miligramos cada cuatro a seis horas.
- 8.- La diuresis debe ser monitorizada con e fin de identificar rápidamente cualquier indicio de complicación en el sistema renal, como la mencionada necrosis tubular.

ALUCINÓGENOS O PSICOTICOMIMÉTICOS

DEFINICION

Se le denominan drogas alucinógenas o psicoticomiméticas las sutancias que producen alteraciones mentales, emocionales y del comportamiento, semejante a las que caracterizan a la psicosis, con desorganización de la personalidad (que suelen provocar alucinaciones, es decir, falsas impresiones sensoriales).

Desde el punto de vista farmacológico, estas drogas con de gran importancia, pues se emplean para crear psicosis experimentales o modelos que permiten estudiar la acción de diferentes fármacos sobre las mismas, sin embargo, no han sido usadas ampliamente como medio terapéutico.

CLASIFICACIÓN

Los alucinógenos se pueden clasificar en seis grupos integrados por sustancias de diversa identidad química:

- a) Derivados del ácido lisérgico
- b) Indolaquilaminas (triptaminas)
- c) Feniletilaminas
- d) ésteres del piperidilbenzilato
- e) Cannabinoides
- f) Otros

Excepto los ésteres benzilato y su grupo relativo de compuestos (los fenilcicloexilos, que son producto de una química orgánica sintética), todas las drogas representativas de estas clases han sido aisladas de sustancias naturales. Además, la mayoría de los alucinógenos identificados hasta la fecha con alcaloides, esto es, que tiene propiedades alcalinas.

ACCIÓN FARMACOLÓGICA.

En este aspecto, y tomando como base el LSD y la mezcalina, las drogas alucinógenas o psicotomiciméticas son muy parecidas entre sí. Desarrollan acciones psíquicas, motoras o autonómicas después de administrarse y de un periodo latente de media hora o un poco menos vía oral, o un cuarto de hora o menos por vía intramuscular. Esto es, se presenta una fase de excitación psíquica acompañada de alteraciones del Sistema Nervioso Autónomo (midriasis, taquicardia y salivación), alucinaciones visuales ricas en contenido y con la sensación de movimiento, en estado placentero y eufórico que, al desaparecer, puede desencadenar un cuadro de ansiedad y aun desembocar en uno de angustia. Posteriormente a las alucinaciones aparece un trastorno de la personalidad conocido con el nombre de despersonalización, en el que el sujeto pese a que está consciente, se siente ajeno a sí mismo.

En el ser humano, sin embargo, no se presentan efectos motores intensos, a excepción de una ligera ataxia y temblores. El electroencefalograma revela una reacción de despertar o de desincronización.

Por otra parte, estas sustancias poseen una acción simpaticomimética singular cuya semejanza química con la coradrenalina es importante. Es decir, actúan sobre el Sistema Nervioso central y el Sistema Nervioso Periférico. Por eso produce midriasis, taquicardia, hiperglucemia y piloerección. En cuanto a los órganos aislados, los efectos simpaticomiméticos incluyen contracción del útero, vasoconstricción, broncodilatación (mezcalina) y broncoconstricción (LSD).

FARMACOCINÉTICA

Estas drogas se absorben bien por vía oral y parental; además, se distribuyen en todos los órganos, metabolizándose casi por completo. Esto determina que se mínima la cantidad que se detecta en la orina sin manifestar cambio.

Sus efectos llegan a la máxima intensidad una o dos horas después de la administración, y persisten durante nueve a doce horas.

USOS CLÍNICOS

La lisérgida y la psilocibina se llegaron a usar como adjuntos en psicoterapia; además la lisérgida también se empleó en el tratamiento de alcoholismo crónico.

En la actualidad, estas drogas ya no se utilizan, por su gran potencial de adicción psíquica y peligrosidad, que incluye psicosis duraderas de tipo esquizofreniforme o maníaco depresivo.

POSOLOGÍA

La dosis de LSD que produce alucinaciones oscila entre los 100 y los 750 microgramos, por vía oral; y la de mezcalina, entre los 400 y 700 miligramos, inyectados.

Signos y síntomas de intoxicación aguda.

Midriasis, visión borrosa, distorsión de la percepción, agudeza auditiva, temblor, fiebre, relajación, felicidad, temor o depresión, disociación mental, dificultad para resolver problemas simples, distorsión en la noción del tiempo, fenómenos parecidos a desórdenes psicóticos de la personalidad, alucinaciones y delirios.

TRATAMIENTO

LSD

- 1.- El efecto de la droga desaparece por sí solo unas horas después de la ingestión; sin embargo, hay que cuidar al sujeto para evitar posibles accidentes debido a la imprudencia que genera su estado. Incluso, es necesario protegerlo de sí mismo.
- 2.- Aplicar cinco miligramos de haloperidol en forma intramuscular cada ocho horas hasta que el efecto de la droga desaparezca, o bien hacer el tratamiento sintomático.
- 3.- El tratamiento, empero, es generalmente de protección y sintomático.

MARIGUANA

- 1.- El tratamiento es fundamentalmente sintomático.

2.- Proceder como si se tratase de una depresión fisiológica; es decir, mantener las vías respiratorias abiertas para que haya oxigenación y movilización del bióxido de carbono, y cuidar que la presión sanguínea conserve niveles adecuados.

3.- Si la droga ha sido ingerida, intentar su eliminación por medio de vómito, pero sólo si el paciente está consciente. De lo contrario hay que realizar un lavado gástrico después de la introducción cuidadosa de una sonda endotraqueal. La catarsis debe ser introducida en el estómago con una solución de 30 miligramos de sulfato de sodio en 250 mililitros de agua, luego del lavado gástrico.

4.- Los analépticos, como la cafeína, son poco recomendables, aunque sí pueden usarse si no hay depresión respiratoria.

5.- Hay que estar alerta por las complicaciones que podrían presentarse como resultado de la terapia estimulante. Por ejemplo: arritmias, convulsiones, falla cardíaca, etc.

6.- Si hay un estado de excitación puede tratarse con haloperinol: cinco mg. Im cada ocho horas.

MEZCALINA

1.- Provocar vómito.

2.- Efectuar lavado gástrico, dejando una solución de sulfato de sodio (30 miligramos en 250 mililitros de agua) en el estómago como catártico.

3.- En general sólo debe darse tratamiento sintomático, dado que la mezcalina produce una psicosis tóxica de duración breve, si bien lo prolongado del efecto depende de la dosis.