

FARMACOLOGIA
UNIDAD N° 2
BRONCODILATADORES

Los broncodilatadores son fármacos que causan la dilatación de los bronquios y los bronquiolos de los pulmones, provocando una disminución en la resistencia aérea y permitiendo así el flujo de aire

EXISTEN TRES GRUPOS DE FÁRMACOS USADOS COMO BRONCODILATADORES:

Broncodilatador agonista Beta2 de acción rápida

Es uno de los broncodilatadores más usados cuando se desea que el efecto sea rápido. Al usar este tipo de broncodilatador, se espera que el tiempo de respuesta del compuesto farmacológico sea menor a 5 minutos. Sin embargo, el efecto desaparece entre 4 y 6 horas después de haberse aplicado. Entre los broncodilatadores agonistas de acción rápida se encuentran: **terbutalina y salbutamol**.

Broncodilatador agonista Beta2 de acción lenta

Al contrario de los broncodilatadores de acción rápida, este tipo de fármaco no hace efecto hasta 20 minutos después de haber sido aplicado. No obstante, ofrecen un efecto prolongado de hasta 12 horas. En el caso de este broncodilatador (en el que podemos encontrar **el formoterol** o el **salmeterol**), el efecto deseado puede durar hasta 24 horas. Los broncodilatadores de acción lenta se indican (en la mayoría de veces) para controlar padecimientos como la EPOC.

Broncodilatador anticolinérgico de acción corta Los broncodilatadores de carácter anticolinérgico ayudan a bloquear algunos receptores de acetilcolina, en especial los muscarínicos y nicotínicos, los cuales pueden generar malestares cuando se presenta alguna enfermedad respiratoria. El broncodilatador de carácter anticolinérgico de acción corta tarda alrededor de 15 minutos en hacer efecto. Sin embargo, la duración del efecto deseado es de 6 a 8 horas. **Bromuro de Ipratropio**

Broncodilatador anticolinérgico de acción prolongada

A comparación del broncodilatador anticolinérgico de acción corta, el de acción prolongada tarda cerca de 20 minutos en hacer efecto y su efecto puede durar hasta 12 horas. **Bromuro de Tiotropio**

Broncodilatador de teofilina

Es uno de los broncodilatadores más potentes que hay, el cual ofrece relajación en la fibra muscular lisa en la región bronquial y de los vasos periféricos. Tiende a aumentar el aclaramiento mucociliar y posee algunas cualidades antiinflamatorias. Sin embargo, al usar este broncodilatador, el paciente deberá realizar exámenes de sangre de manera regular afín de evitar lo altos niveles de teofilina en la sangre, ya que los efectos secundarios de una sobredosis suelen ser riesgosos para la salud. Cabe destacar que es un broncodilatador que se administra en forma de comprimido, no como los anteriores que se administran por medio de inhalaciones.

Broncodilatadores y corticosteroides

Los corticosteroides inhalados son el tratamiento principal para reducir la inflamación y prevenir los brotes de asma. Pero algunas personas también se benefician al tomar broncodilatadores para mantener abiertas las vías respiratorias y aumentar los efectos de los corticosteroides, por lo que los broncodilatadores de acción prolongada nunca deben tomarse sin corticosteroides.

De acuerdo a la **clasificación** de beta adrenérgicos corresponde a aquellos que dilatan las vías respiratorias bronquiales al relajar los músculos que rodean las vías respiratorias. Los broncodilatadores **beta-adrenérgicos son agonistas beta-2**. Estos fármacos **estimulan los receptores beta-2 en las células del músculo liso que recubren las vías respiratorias**, lo que hace que estas células musculares se relajen y, por lo tanto, abran las vías respiratorias.

Por consiguiente, los **broncodilatadores anticolinérgicos** bloquean el efecto de la acetilcolina en las vías respiratorias y los conductos nasales. La acetilcolina es un químico que los nervios utilizan para comunicarse con las células musculares.

Mecanismos de acción

En el mismo orden de ideas, se sugiere que la fisiopatología de la enfermedad pulmonar obstructiva crónica se caracteriza por un aumento centralmente mediado del tono colinérgico. Los β -agonistas actúan uniéndose a los receptores adrenérgicos, que estimulan la broncodilatación a través de la mediación del sistema de segundo mensajero de AMP cíclico (cAMP). Se postula que la teofilina estimula la broncodilatación al inhibir la fosfodiesterasa y la adenosina.

La inhibición de la fosfodiesterasa prolonga las acciones de cAMP y da como resultado la broncodilatación. Los anticolinérgicos inhalados de acción prolongada actúan antagonizando las acciones de la acetilcolina, produciendo la relajación del músculo liso de las vías respiratoria

Igualmente, los broncodilatadores funcionan a través de su efecto de relajación directa sobre las células del músculo liso de las vías respiratorias. Una descripción esquemática de la innervación de las vías respiratorias es fundamental para comprender cómo funcionan los broncodilatadores y por qué tienen utilidad clínica. El **tono** de las vías respiratorias está controlado principalmente por el nervio **vago**, y **los nervios parasimpáticos transportados en el nervio vago** son tónicamente activos, produciendo un tono de línea estable, fácilmente reversible del músculo liso de las vías respiratorias.

Glucocorticoides

Los glucocorticoides son hormonas esenciales para la vida, ya que su acción principal es ayudar al proceso metabólico del ser humano

La secreción de estas hormonas es controlada por el eje hipotálamico-pituitario-adrenal. La hormona liberadora de corticotropina (CRH por sus siglas en inglés), que actúa en el anterior pituitario para estimular la secreción hipofisiaria de la hormona adrenocorticotrópica (ACTH por sus siglas en ingles).

La ACTH es otra hormona que actúa sobre la corteza suprarrenal para estimular la producción y la secreción de los **glucocorticoides**, formando así una dependencia de una hormona con la otra para su funcionamiento.

En la mayoría de los casos, las personas que sufren de depresión corporal, la glucocorticoide funciona para mantener la homeostásis, tanto en respuesta a los cambios en el metabolismo normal, como en las perturbaciones desagradables.

Las hormonas glucocorticoides regulan los procedimientos fisiológicos incluyendo el metabolismo y la **función cardiovascular**.

Usos medicos:

Los glucocorticoides son poderosos medicamentos que combaten la inflamación y funcionan con su sistema inmunológico para tratar una amplia gama de problemas de salud.

Nuestro organismo realmente produce sus propios glucocorticoides. A veces, sin embargo, no son suficientes. Ahí es cuando las versiones hechas por el hombre pueden ayudar.

Mecanismo de acción

La inflamación es la respuesta del sistema inmune a una lesión o infección. Hace que el cuerpo produzca más glóbulos blancos y productos químicos para ayudarlo a sanar. A veces, sin embargo, esa respuesta es demasiado fuerte e incluso puede ser peligrosa.

El **asma**, por ejemplo, es una inflamación en sus vías respiratorias que puede impedirle respirar. Ante una enfermedad autoinmune, el organismo desencadena la inflamación por error. Eso significa que el sistema inmune ataca las células y los tejidos sanos como si fueran virus o bacterias.

Los glucocorticoides evitan que el organismo produzca muchos de los químicos involucrados en la inflamación.

Tipos de glucocorticoides

Un glucocorticoide es un tipo de **esteroide**. El tipo que necesita depende de la condición de salud específica que tenga.

Entre los más comunes están:

- **Cortisona**: que puede aliviar la inflamación en sus articulaciones.
- **Triamcinolona**: trata las condiciones de la piel.
- **Budesonida**: para la [colitis ulcerosa](#) y la [enfermedad de Crohn](#), enfermedades autoinmunes que afectan su tracto digestivo. Epoc en afecciones respiratorias.
- **Prednisona ,Dexametasona, Fluticasona**: píldoras que tratan alergias, artritis, asma, problemas de visión y muchas otras afecciones.

Los glucocorticoides tratan muchas condiciones que son causadas por la inflamación, como:

- [Asma](#).
- Enfermedad pulmonar obstructiva crónica (EPOC).
- Alergias.
- Artritis Reumatoide.
- Osteoartritis.
- Enfermedad de Crohn y otros tipos de enfermedad inflamatoria intestinal.
- Eccema y otras afecciones de la piel.
- Esclerosis múltiple.
- Tendinitis.
- Lupus.

Efectos secundarios

- Aumento de peso.
- Sentirse muy hambriento.
- Retención de agua o hinchazón.
- Cambios de humor.

- Nerviosismo o inquietud.
- Visión borrosa.
- Problemas para dormir.
- Debilidad muscular.
- [Acné](#).
- Irritación estomacal.

Antileucotrienos

Los leucotrienos son **hormonas que se derivan del ácido araquidónico** y son producidas por los glóbulos blancos. Causan inflamación, retención de líquido, secreción mucosa y opresión en los pulmones. Los inhibidores de leucotrieno son medicamentos que disminuyen la inflamación al prevenir la acción de los leucotrienos. Los antileucotrienos son **uno de los tratamientos del asma y rinitis más desconocidos por los pacientes**. Actúan bloqueando la acción de unas sustancias inflamatorias conocidas como leucotrienos. Éstas aumentan mucho en los bronquios y mucosa nasal cuando hay una crisis de asma o rinitis.

Mecanismo de acción:

El bloqueo de la acción de los receptores de leucotrienos tiene dos abordajes principales, la inhibición de la cascada del AMPc y el agonismo de los receptores cisteinil-leucotrieno tipo 1.

Inhibición de la cascada de la 5-lipooxigenasa

Ciertos medicamentos como el **zileutón** bloquean la molécula **5-lipooxigenasa**, lo que conlleva a una inhibición del **metabolismo** de los leucotrienos, mientras que otras **drogas** como el **MK-886** bloquean la [proteína activadora de la 5-lipooxigenasa](#) y promueven el tratamiento de la [arteriosclerosis](#).

Antagonismo de los receptores de la cisteinil-leucotrieno tipo 95.

Ciertos agentes como el **montelukast**, [pranlukast](#) y el **zafirlukast** bloquean las acciones de los cisteinil-leucotrienos a nivel del receptor [CysLT1](#) en [células](#) diana tales como el [músculo liso](#) de los [bronquios](#). Ello demuestra que estos agentes tienen propiedades anti-inflamatorias y antifibróticas.

Los inhibidores de leucotrieno son medicamentos que disminuyen la inflamación al prevenir la acción de los leucotrienos. Estos tipos de medicamentos no se usan para aliviar los síntomas agudos, pero se pueden usar para prevenir sus síntomas.

Algunos ejemplos de inhibidores de leucotrieno que están disponibles incluyen:

- **Montelukast** (Singulair).
- **Zafirlukast** (Accolate).
- Zileuton (Zyflo).