

Alprazolam

Blanco farmacológico

AGONISTAS ALOSTERICOS DEL RECEPTOR GABAA (SUBUNIDAD ALFA 1, 2 Y 5). BLOQUEA DESCARGAS POSITIVAS DE ALTA FRECUENCIA. ACTUA INCREMENTANDO LA ACTIVIDAD DE GABA, NEUROTRANSMISOR INHIBIDOR.

Efecto farmacológico

ACTÚA A NIVEL DE LAS REGIONES LIMBICAS, TALAMICA E HIPOTALAMICA DE SNC, PRODUCIENDO DEPRESIÓN DE SU ACTIVIDAD. PRODUCIENDO SEDACIÓN, EFECTO DE HIPNOSIS RELAJACIÓN MUSCULAR Y REDUCIENDO LA ACTIVIDAD CONVULSIVANTE DEL PACIENTE.

Usos terapéuticos

EN ADULTOS EN ANSIEDAD Y TRASTORNO DE PANICO. EN NIÑOS Y ADULTOS MAYORES EN ANSIEDAD, TRASTORNO DE PANICO Y DEPRESION. TRATAMIENTO AGUDO DE CRISIS DE ANGUSTIA (AGORAFOBIA, DIFICULTAD DE CONCENTRACION, IRRITABILIDAD, INSOMNIO.

Farmacocinética relevante

SE ABSERBE BIEN POR V.O. ALCANZANDO PICOS PLASMATICOS ENENTRE 1 Y 2 HORAS, LA VIDA MEDIA ES DE 12 A 15 HRS. Y SE DESECHA POR LA URINA, TIENE UNA ALTA BIODISPONIBILIDAD Y LIPOSOLUBILIDAD GRACIAS A ESTO ATRAVIESA FACIL LA BARRERA HEMATOENCEFALICA.
BIODISPONIBILIDAD: 90%, UNION A PROTEINAS 80%, ES METABOLIZADO POR CYP3A4, EXCRETADOS COMO GLUCURONIDOS O METABOLITOS OXIDADOS.

Reacciones adversas

COLOR AMARILLENTO DE PIEL Y CONJUNTIVAS, MUCOSA ORAL SECA SIALORREA. CRISIS CONVULSIVAS, DEBILIDAD MUSCULAR, ALTERACIONES DE LA COORDINACION MOTORA, SEDACION, ADORMECIMIENTO, MAREO, IRRITABILIDAD, VERBORREA

Riesgo de embarazo

ES CLASIFICACION "D", EL USO CRONICO DE ESTE ANSILITICO DURANTE EL EMBARAZO PUEDE CAUSAR SINDROME DE ABSTINENCIA NEONATAL, IRRITABILIDAD, HIPERACTIVIDAD MOTORA INCLUSO CONVULSIONES CON PARADA CARDIORESPIRATORIA.

Perfil de Seguridad

EL ALCOHOL Y OPIOIDES PUEDEN POTENCIAR LOS EFECTOS DEPRESORES SOBRE EL SNC (EL ALCOHOL ESPECIALMENTE LA ACTIVIDAD PSICOMOTRIZ). CLOZAPINA, HALOPERIDOL: ↑ DE HIPOTENSION, DEPRESIÓN RESPIRATORIA. LOS ANTIFÚNGICOS AZOLES PROVOCAN LA ACUMULACIÓN ORGÁNICA DE BENZODIAZEPINA.

Diazepam

AGONISTAS ALOSTERICOS DEL RECEPTOR GABAA (SUBUNIDAD ALFA 1, 2 Y 5). BLOQUEA DESCARGAS POSITIVAS DE ALTA FRECUENCIA. GABA ES UN TRANSMISOR IMPORTANTE EN EL SNC. LOS REFLEJOS DEL HUSO POLI SINÁPTICO SE INHIBEN PRODUCIENDO LA RELAJACIÓN DEL MÚSCULO ESQUELÉTICO. LA TRANQUILIZACIÓN SE LOGRA MEDIANTE LA INHIBICIÓN DEL SISTEMA LIMBICO.
LAS BENZODIAZEPINAS EJERCEN SU EFECTO FARMACOLÓGICO EN EL SITIO DE LA SINAPISIS DE GABA, AUMENTANDO LA AFINIDAD DEL RECEPTOR POR GABA, REDUCIENDO ASÍ LA ROTACIÓN DE GABA.

INCREMENTA LA CONDUCTANCIA DE CLORO., HIPERPOLARIZACION NEURONAL.
SUS EFECTOS MAS PROMINENTES SON LA SEDACION, EFECTO DE HIPNOSIS, DISMINUCION DE LA ANSIEDAD, RELAJACION MUSCULAR, AMNESIA ANTEROGADA Y ACTIVIDAD ANTICONVULSIVA.

ES UNA OPCIÓN PARA LOS ESPASMOS MUSCULARES DEL TÉTANOS. EFECTIVIDAD INCIERTA PARA LA ESPASTICIDAD DE LA PARÁLISIS CEREBRAL. ANTICONVULSIVANTE. SU EFICACIA PARA YUGULAR LAS CRISIS Y SU PERFIL SEGURO, ASÍ COMO LA POSIBILIDAD DE ADMINISTRACIÓN RECTAL LO HACEN UN FÁRMACO HABITUAL EN EL TRATAMIENTO DE LAS CRISIS Y DEL ESTATUS EPILÉPTICO

SI SE ADMINISTRA V.O.: TIENE UN TIEMPO DE ABSORCION DE 30 A 90 MIN, POR VIA IM: 90 MIN, RECTAL: T1/2: 43+-13 HR
RECTAL: 90%. BIODISPONIBILIDAD: 90%. DISMINUYE SI SE TOMA CON ALIMENTOS. TIENE UNA DISTRIBUCION RAPIDA ESPECIALMENTE EN CEREBRO E HIGADO. ES METABOLIZADO POR CYP3A4 Y 2C19. SE ELIMINA POR VIA RECTAL VME: 20 A 50

NEUTROPENIA, DEBILIDAD MUSCULAR, HIPOTENSION, ATAXIA, DEPRESION RESPIRATORIA, FATIGA, DISMINUCION DEL SUEÑO REM, AMNESIA ANTEROGADA, SOBRESIEDACION, CAÍDAS Y FRACTURAS (ESTO EN ADULTOS MAYORES).

ES CLASIFICACION "D", SE EXCRETA POR LA LECHE MATERNA, LOS NEONATOS METABOLIZAN LENTOS Y ESOTS PUEDEN LLEGAR A NIVELES TOXICOS, DEBIDO A ESTO SU USO NO SE RECOEMINDA EN MADRES LACTANTES.

INHIBIDORES E INDUCTORES DE LOS CYP, FLUMAZENILO, ETANOL Y OTROS DEPRESORES DEL SNC
CONTRAINDICADO

HIPERSENSIBILIDAD, MIASTENIA GRAVIS, GLAUCOMA, MENORES DE 6 MESES DE EDAD, INSUFICIENCIA HEPÁTICA AGUDA, INSUFICIENCIA RESPIRATORIA, APNEA DEL SUEÑO.

Triazolam

Zolpidem

Blanco farmacológico

AGONISTA ALOSTÉRICO DEL RECEPTOR GABAA. ACCIONES MEDIADAS POR LA ACTIVACIÓN DE SUBTIPOS ESPECÍFICOS DE RECEPTORES TIPO A DEL GABA, FACILITANDO LA TRANSMISIÓN INHIBIDORA MEDIADA POR GABA. MODULAN EL COMPLEJO QUE PERMITE UNA MAYOR AFINIDAD DEL GABA POR SUS RECEPTORES ORIGINANDO UNA MAYOR APERTURA DEL CANAL DE IONES CLFAVORECIENDO EL INGRESO DE IONES CLORO A LA CÉLULA, QUE GENERA HIPERPOLARIZACIÓN CELULAR Y ASÍ DISMINUYE LA EXCITABILIDAD NEURONAL.

AGONISTA ALOSTÉRICO DEL RECEPTOR GABAA. SE UNE A LA SUBUNIDAD ALFA-1 DEL RECEPTOR GABAA, AUMENTA LA FRECUENCIA DE APERTURA DE CANALES DE CLY POR LO TANTO INHIBE LA EXCITACIÓN NEURONAL

Efecto farmacológico

ACTÚA A NIVEL DE LAS REGIONES LÍMBICAS, TÁLAMO, HIPOTÁLAMO DEL SISTEMA NERVIOSO CENTRAL PRODUCIENDO DEPRESIÓN DEL SNC INCLUYENDO LA SEDACIÓN Y LA HIPNOSIS, ASÍ COMO LA RELAJACIÓN DEL MÚSCULO ESQUELÉTICO Y UNA ACTIVIDAD ANTICONVULSIVA.

TRATAMIENTO A CORTO PLAZO DE INSOMNIO (5-10MG). ACTUA EN EL SISTEMA NERVIOSO CENTRAL PRODUCIENDO DEPRESIÓN DEL SNC INCLUYENDO LA SEDACIÓN Y LA HIPNOSIS, ASÍ COMO REALENTIZAR LA ACTIVIDAD DEL CEREBRO PARA PERMITIR EL SUEÑO.

Usos terapéuticos

SE USA PARA TRATAR EL INSOMNIO. SU ACCIÓN CONSISTE EN HACER MÁS LENTA LA ACTIVIDAD DEL CEREBRO PARA PERMITIR EL SUEÑO.

ESTA INDICADO EN EL TRATAMIENTO A CORTO PLAZO DEL INSOMNIO EN ADULTOS, SOLO ESTA INDICADO CUANDO EL TRASTORNO ES GRAVE, LIMITA LA ACTIVIDAD DEL PACIENTE O LO SOMETE A UNA SITUACIÓN DE ESTRÉS IMPORTANTE.

Farmacocinética relevante

POR V.O. T1/2: 2.9--1 HR.
POR V.O. ES RÁPIDA Y COMPLETA. BIODISPONIBILIDAD 99-100% TMAX: 1-2 HRS. LOS ALIMENTOS REDUCEN SU ABSORCIÓN. DISTRIBUCIÓN: UNIÓN A PROTEÍNAS 89-94%. BIOTRANSFORMACIÓN HEPÁTICA. SE METABOLIZA POR P450 CYP3A4, HIDROXILACIÓN Y OXIDACIÓN, METABOLITO PRINCIPAL: ALFAHIDROXITRIAZOLAM. SE EXPULSA POR VÍA RENAL 79.9%, VME: 1.5 - 5.5 HRS

VIA ORAL O SUBLINGUAL. LA CONCENTRACION PLASMÁTICA MÁXIMA SE ALCANZA ENTRE 30 MIN Y 3 HRS DE LA ADMINISTRACION. BIODISPONIBILIDAD: 70%, CON ALIMENTOS SE RETRASA SU ABSORCIÓN. DISTRIBUCIÓN: UNIÓN A PROTEÍNAS 92.5%. BIOTRANSFORMACIÓN: HEPÁTICA, SE METABOLIZA SE METABOLIZA POR OXIDACIÓN DEL GRUPO METIL PARA PRODUCIR ÁCIDOS CARBOXÍLICOS. SU ELIMINACION ES RENAL 56% HECEs: 37% VME: 2.4 HRS.

Reacciones adversas

HEPATOTOXICIDAD, SOMNOLENCIA, DISTONÍA, APNEA, DEPRESIÓN RESPIRATORIA. DISMINUCIÓN DEL SUEÑO REM, AMNESIA ANTERÓGRADA, SOBRESIEDACIÓN, CAÍDAS Y FRACTURAS (ESPECIALMENTE ADULTO MAYOR)

SOMNOLENCIA DIURNA, DESORIENTACIÓN, ANSIEDAD, DOLOR DE CABEZA, MAREOS, DESORIENTACION, ANSIEDAD Y ALUCINACIONES. TOLERANCIA Y ABSTINENCIA (DISMINUCIÓN DE LA EXPRESIÓN DE LOS RECEPTORES GABAA), DISMINUCIÓN DEL SUEÑO REM, AMNESIA ANTERÓGRADA, SOBRESIEDACIÓN, CAÍDAS Y FRACTURAS (ESPECIALMENTE ADULTO MAYOR).

Riesgo de embarazo

ES CATEGORÍA "X". ESTUDIOS REALIZADOS SUGIEREN RIESGO AUMENTADO DE MALFORMACIONES CONGENITAS. ESTA CONTRAINDICADO EN CUALQUIER ETAPA DEL EMBARAZO. EN LA LACTANCIA EVITAR, SE EXCETA.

ES CATEGORÍA "C", NO SE RECOMIENDA SU USO DURANTE LA LACTANCIA, LOS RIESGOS SON BAJOS. SE DEBE EVITAR EN EL PRIMER TRIMESTRE DE EMBARAZO, ASÍ MISMO SI SE PIENSA QUEDAR EMBARAZADA ACUDIR AL MÉDICO PARA SUSPENDER EL TRATAMIENTO.

Perfil de Seguridad

EN CASOS DE HIPERSENSIBILIDAD AL TRIAZOLAM O A OTRAS BENZODIAZEPINAS, ENFERMEDAD PULMONAR OBSTRUCTIVA CRÓNICA, INSUFICIENCIA RESPIRATORIA, DEPRESIÓN MENTAL GRAVE, INTOXICACIÓN ALCOHÓLICA, ASÍ COMO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA. INTERACTÚA CON NUMEROSOS FÁRMACOS, EN PARTICULAR CON LOS DEPRESORES DEL SISTEMA NERVIOSO CENTRAL QUE HACEN QUE AUMENTE SUS EFECTOS DEPRESORES.

LOS PACIENTES DEBEN EVITAR CONDUCIR O MANEJAR MAQUINARIA O REALIZAR OTRAS TAREAS QUE REQUIERAN ALERTA MENTAL DESPUES DE TOMAR SU DOSIS. ALCOHOL, ANSOLITICOS, ANTIDEPRESIVOS, ANTIEPILEPTICOS, ANESTESICOS, ANTIESTAMINICOS PUEDEN AUMENTAR LOS EFECTOS DEPRESORES SOBRE EL SNC.