

[www.udhboulogne.tk](http://www.udhboulogne.tk)

# BETA BLOQUEANTES

Pablo R. Landolfo

# Receptores Beta adrenérgicos

- $\beta_1$ : corazón y riñón
- $\beta_2$ : músculo liso y vasos periféricos
- $\beta_3$ : tejido adiposo

Lipoproteínas asociadas a Adenilatociclasa  
Up & Down - regulation

# **Beta Bloqueantes**

- Bloquean los receptores  $\beta$  adrenérgicos, produciendo disminución de AMPc
- Derivados del Isoproterenol
- BLOQUEO COMPETITIVO
- Acción depende de función del receptor y de las condiciones del paciente

# **PROPIEDADES** **ESPECÍFICAS**

- 1) Cardioselectividad
- 2) Actividad simpaticomimética intrínseca
- 3) Actividad estabilizadora de membrana
- 4) Bloqueo alfa
- 5) Antiarrítmico clase III

# Cardioselectividad

- Bloqueo  $\beta_1$
- Dosis dependiente
- Ventajas: menor BC y VC

Atenolol

Acebutalol

Metoprolol

Bisoprolol

Esmolol

# ASI

- Agonista parcial
- Depende de actividad simpática basal
- Ventajas: menor bradicardia en reposo
- BD no relevante

Acebutalol

Carteolol

Pindolol

# **AEM**

- Efecto quinidino símil
- A dosis muy altas
- Independiente del betabloqueo
- Acción antiarrítmica poco relevante

Acebutalol

Carvedilol

Metoprolol

Propranolol

# **Bloqueo alfa**

- Caída más rápida de la TA
- < BC y < VC
- > Ortostatismo y eyaculación retrógrada

Carvedilol

Labetalol

# Antiarrítmico clase

III

- Bloquea canales de K+
- Prolonga período refractario de A, V, NAV y vías accesorias

Sotalol

# **EFECTOS CV**

- Disminuye FC !!!
- Disminuye FSVI en esfuerzo
- Aumenta FSVI en isquemia, y a largo plazo en MCPD
- Aumenta RVS (x liberación alfa)
- Aumenta resistencia coronaria (pero disminuye la demanda de O<sub>2</sub>)

# Paciente betabloqueado

- FC en reposo: 50 - 60 lat x min
- FC en ejercicio: 90 - 100 lat x min
- En casos especiales, signos de:
  - Broncoespasmo
  - Insuficiencia cardíaca
  - Retención hidrosalina

# **FARMACOCINÉTICA**

- Buena biodisponibilidad VO
- EV: Esmolol, Propranolol, Atenolol, Labetalol
- Generalmente metabolismo hepático
- 1 toma diaria: por lenta disociación
- Duración efecto depende de la dosis

# FARMACOCINÉTICA

	Abs VO	UAP	Hepat	T1/2	Excr
Atenolol	50 %	10 %	-	6 – 7 hs	Renal
Carvedilol	25 %	95 %	++	6 – 10 hs	Hepática
Esmolol	IV	55 %	-	9 min	Renal
Labetalol	25 %	50 %	++	6 – 8 hs	Ren y Hep
Propranolol	10 %	90 %	++	4 – 6 hs	Hepática

# **USOS**

- 1) Cardiopatía isquémica
- 2) HTA
- 3) Insuficiencia Cardíaca
- 4) Otros

# **OTROS USOS**

- 4) Hipertiroidismo: disminuye síntomas e inhibe conversión periférica T4 → T3
- 5) Feocromocitoma: luego del alfa bloqueo
- 6) Temblor esencial (receptores β centrales)
- 7) Migraña
- 8) Ansiedad y pánico: mejora síntomas
- 9) Glaucoma: Timolol y Carteolol
- 10) Taquiarritmias
- 11) Profilaxis sangrado varicial

# **EFECTOS ADVERSOS**

- **Cardiovasculares:** bradicardia, hipotensión, IC, BAV 2 y 3°, Raynaud, extrem frías
- **SNC:** mareos, debilidad, insomnio, confusión, depresión.
- **GI:** constipación, náuseas, diarrea
- **Genitourinario:** Impotencia
- **Respiratorios:** disnea, broncoespasmo
- **Metabólico:** Hipoglucemia, alteración perfil lipídico (aumenta TG, disminuye HDL)

# **CONTRAINDICACIONES**

**A** : Asma / EPOC

**B** : Bloqueo AV / Bradicardia

**C** : Insuf cardíaca descompensada

**D** : DBT

**E** : Embarazo

**F** : Fenómeno de Raynaud

# **VASODILATADORES**

## **Arteriales:**

- Hidralazina
- Minoxidil
- Diazóxido
- Fenoldopam

## **Arteriales y Venosos:**

- Nitroprusíato

# Hidralazina

Mecanismo de acción no conocido

VO, buena Abs. Baja BD. T1/2 corta, efecto duradero. MTB: N-acetilación

Potente estimulación simpática-SRAA

Efectos adversos inmunológicos

Usos: *urgencia HTA del embarazo*

**Cl: Cardiopatía Isquémica y Aneurisma de Aorta**

# Minoxidil

- Activa canales de K<sup>+</sup> ATP dependientes
- VO, Buena Abs, MTB hepático, 20% excreción renal sin cambios. T1/2: 3 hs, duración del efecto 24 hs.
- Muy potente, difícil manejo,
- HIPERTRICOSIS.
- Reservado para la HTA grave y resistente.  
Combinar con diuréticos y simpaticolíticos (BB)

# Diazóxido (benzotiadiazinas)

- Activa canales de K<sup>+</sup> ATP dependientes
- Adm IV rápida o lenta. 50% eliminación renal sc.
- Difícil manejo
- Reservado para la **urgencia HTA grave cuando no se dispone de BIC lenta o no es factible realizar un buena vigilancia continua de la TA.**
- Altera Hipoglucemiantes orales, el gusto y el olfato.