2. FÁRMACOS CON ACCIÓN EN EL SISTEMA NERVIOSO

2.1. Anestésicos generales

2.1.1. Etomidato

- *Presentación:* ampolla de 20 mg en 10 ml.
- *Nombre comercial:* Hypnomidate®.
- *Vías de administración:* IV.
- *Farmacología:* hipnótico de duración corta con escaso efecto depresor cardiorrespiratorio. Disminuye el flujo sanguíneo y el consumo cerebral de O_2, prestando propiedades anticonvulsivas, un efecto pro-

tector de las células cerebrales frente a la hipoxia y un ligero descenso de la PIC.

- *Indicaciones:* inducción de la anestesia en pacientes con inestabilidad HD, TCE, HTIC, hipotensión y glaucoma de ángulo estrecho.

- *Farmacocinética:* inicio de acción IV inmediato con pico en 1 min y duración de 5-10 min. Metabolismo hepático. Eliminación renal.

- *Dosis:* en adultos bolo inicial IV de 0,3 mg/kg (0,15 ml) administrado en 30 segundos para producir un sueño de 5 min, prorrogable con bolos de 0,1-0,2 mg/kg hasta un máximo 60 mg. En niños 0,2-0,4 mg/kg hasta un máximo 20 mg.

- *Efectos secundarios:* supresión de la función de la corteza suprarrenal, depresión respiratoria, hipotensión, discinesia, mio-

clonía, nistagmo, bradicardia, extrasístoles, apnea, vómitos, náuseas, eritema.

- *Sobredosis:* no existe antídoto; tratamiento sintomático. En caso de evolucionar la depresión respiratoria hacia parada se debe establecer soporte respiratorio. Hay que valorar la inyección de hidrocortisona.
- *Contraindicaciones:* hipersensibilidad al PA o excipientes (soja, cacahuete), niños menores de 6 meses, sepsis, trasplante, embarazo y lactancia. Precaución en porfiria y disfunción adrenocortical.
- *Embarazo:* categoría FDA-C.
- *Interacciones:* su efecto aumenta con fármacos neurolépticos, opioides, sedantes y alcohol, así como disminuye con alfentanilo. Evitar la terapia concomitante con IMAOS: interrumpir el tratamiento con

IMAOS dos días antes del proceso anestésico, si está previsto.

- *Consideraciones:* requiere monitorizar ECG, TA y O_2. Los movimientos musculares involuntarios por desinhibición subcortical se reducen con la administración previa de opiáceos (fentanilo) o BZD de acción corta (midazolam). El etomidato no es analgésico.
- *Conservación:* temperatura ambiente, protegido de la luz.

2.1.2. Midazolam

- *Presentación:* ampolla de 15 mg en 3 ml o 5 mg en 5 ml.
- *Nombre comercial:* Dormicum®.
- *Vías de administración:* IV-IM-INH.
- *Farmacología:* BZD de vida muy corta con efecto ansiolítico, amnésico, anticonvulsi-

vante, sedante y miorrelajante, mediante inhibición del GABA. Disminuye el flujo sanguíneo cerebral, PIC, metabolismo, RVP y TA.

- *Indicaciones:* sedación, inducción anestésica, convulsiones, insomnio.
- *Farmacocinética:* inicio de acción IV en 30-60 segundos con pico en 3-5 min y duración de 15-80 min. Metabolismo hepático. Eliminación renal.
- *Dosis:* en adultos para sedación consciente bolo inicial IV de 0,03-0,3 mg/kg diluido en 10 ml de SF administrado en 30-60 segundos, repetible con bolos de 1 mg hasta alcanzar el efecto deseado, normalmente con 4-8 mg; en niños 0,05-0,1 mg/kg. Para la SIR en adultos bolo IV de 0,1-0,4 mg/kg con efecto en 2 min; en niños 0,2 mg/kg. Como inductor anestésico en adultos bolo IV de 0,3 mg/kg y en niños 0,15 mg/kg. El

efecto anticonvulsionante se consigue con bolo IV de 0,025-0,15 mg/kg seguido de una infusión continua a 1-15 µg/kg/min con 100-250 ml de SF. Para una sedación profunda infundir 40-300 µg/kg/h.

- *Efectos secundarios:* hipotensión, alteraciones de la FC, hipoventilación, apnea, broncospasmo, disnea, amnesia, debilidad muscular, euforia, agitación, discinesias, movimientos tónicos, delirio, despertar prolongado, náuseas, sialorrea, rash, prurito, urticaria.
- *Sobredosis:* el antídoto es el flumazenilo.
- *Contraindicaciones:* hipersensibilidad, depresión cardiorrespiratoria, hipovolemia, miastenia gravis, glaucoma de ángulo estrecho, embarazo y lactancia.
- *Embarazo:* categoría FDA-D.

- *Interacciones:* su efecto se potencia con otros depresores centrales, eritromicina, cimetidina, ranitidina, diltiazem, verapamilo, fluconazol, itraconazol, ketoconazol, saquinavir y omeprazol, mientras que disminuye con la fenitoína, rifampicina, carbamacepina y fenobarbital. Reduce la acción de la levodopa. Aumenta el riesgo de arritmias graves en asociación con efavirenz y el de hipotensión con narcóticos.
- *Consideraciones:* requiere monitorizar ECG, TA y O_2. Vigilar los signos de depresión respiratoria y cardiovascular; preparar un equipo de reanimación. La recuperación del nivel de conciencia tras la administración de perfusiones prolongadas puede ser lenta (hasta 72 horas).
- *Conservación:* temperatura ambiente.

2.1.3. Ketamina

- *Presentación:* ampolla de 500 mg en 10 ml.
- *Nombre comercial:* Ketolar®.
- *Vías de administración:* IV-IM.
- *Farmacología:* simpaticomimético generador de anestesia disociativa con reflejos mantenidos como el tusígeno, movimientos coordinados pero inconscientes, analgesia intensa y amnesia. No produce depresión respiratoria, se conservan los niveles de CO_2 espirado; eleva la TA y FC aumentando el flujo sanguíneo cerebral y la PIC.
- *Indicaciones:* sedoanalgesia de corta duración como agente único e inducción anestésica en asociación, especialmente útil en pacientes con inestabilidad HD, shock hipovolémico o séptico, taponamiento cardiaco, asma, pericarditis, traumatismos torácicos y broncoespasmo.

- *Farmacocinética:* inicio de acción IV en 30-60 segundos con pico en 1 min y duración de 5-15 min. Metabolismo hepático. Eliminación renal.

- *Dosis:* en adultos bolo inicial IV de 1-3 mg/kg administrado en 1 min repetible con 1/3 de dosis a los 5-30 min y mantenible con una perfusión a 0,5-2 mg/kg/h (diluir la ampolla en 500 ml de SF o SG5% para obtener una dilución 1 mg/ml); IM 4-13 mg/kg. En niños bolo inicial IV de 0,5-2 mg/kg y perfusión de mantenimiento a 5-20 µg/kg/min.

- *Efectos secundarios:* HTA, TQ, elevación del GC, RVP, PIC y PIO, BD, laringoespasmo, hipersecreción bronquial, vómitos, sialorrea, psicosis, alucinaciones, pesadillas, delirios, comportamiento desordenado, diplopía, nistagmo.

- *Sobredosis:* no existe antídoto; tratamiento sintomático con soporte ventilatorio si se produce una depresión respiratoria severa, aunque por su amplio margen terapéutico no es frecuente.
- *Contraindicaciones:* enfermedades psiquiátricas, HIC, HIO, IAM, ACV, HTA, aneurisma disecante de aorta, epilepsia, neurocirugía, porfiria, eclampsia, alucinaciones.
- *Embarazo:* categoría FDA-B.
- *Interacciones:* evitar en casos de intoxicación por cocaína y terapia con simpaticomiméticos. Las BZD reducen la estimulación simpática y con ello la TA. Administrar verapamilo compensa la HTA, pero no baja la FC. Potencia el efecto de los relajantes musculares no despolarizantes y succinilcolina.
- *Consideraciones:* requiere monitorizar ECG, TA y O_2. Tiene una recuperación des-

agradable con alucinaciones y delirio, que mejora con medidas ambientales y la administración concomitante de BZD a dosis bajas. Una velocidad de administración rápida potencia los efectos depresores, controlables con el empleo de opiáceos, calcioantagonistas, BZD y α/β-bloqueantes. La administración previa de atropina ayuda a controlar la sialorrea y las secreciones de las vías aéreas.

- *Conservación:* temperatura ambiente (< 25 ºC), protegido de la luz.

2.1.4. Propofol

- *Presentación:* ampolla de 200 mg en 20 ml (1%) o de 200 mg en 10 ml (2%).
- *Nombre comercial:* Diprivan®.
- *Vías de administración:* IV.
- *Farmacología:* depresor central por inhibición del GABA, empleado como inductor

anestésico en cirugías cortas por su rápida recuperación, cirugías prolongadas, sedación en cuidados intensivos y RCP. Reduce la PIC y el consumo de oxígeno cerebral, por lo que es especialmente útil en neurocirugía, HTIC y TCE. Produce analgesia.

- *Indicaciones:* sedación, inducción y mantenimiento de la anestesia general, y antiemético en el contexto postoperatorio y quimioterapia.

- *Farmacocinética:* inicio de acción IV en 30-45 segundos con pico en 1 min y duración de 5-20 min. Metabolismo hepático. Eliminación renal.

- *Dosis:* la inducción anestésica en adultos requiere un bolo inicial IV de 1-3 mg/kg administrado en 30 segundos, sostenible mediante bolos de 25 a 50 mg o perfusión 4-12 mg/kg/h; en niños dosis inicial IV de 2,5-3 mg/kg y mantenimiento con 0,125-

0,25 mg/kg/h. Para una sedación corta en adultos administrar un bolo IV de 0,3-1 mg/kg/en 30 segundos.

- *Efectos secundarios:* hipotensión, arritmias, bradicardia, hipoventilación, broncoespasmo, laringoespasmo, movimientos involuntarios, alucinaciones, hipertrigliciremia, xerostomía, náuseas, hipomotilidad intestinal, espasmo biliar, retención urinaria, mareo, sudoración, miosis, cefaleas, inquietud, ilusiones sexuales, eritema, urticaria.
- *Sobredosis:* no existe antídoto específico; tratamiento sintomático con medidas posicionales, administración de volumen, fármacos vasopresores y ventilación mecánica en caso de depresión cardiorrespiratoria.
- *Contraindicaciones:* alergia al huevo, glicerol y soja, niños menores de 3 años, pacientes HD inestables, cardiopatía, epilepsia.

- *Embarazo:* categoría FDA-B.
- *Interacciones:* el fentanilo, remifentanilo y halotano aumenta el efecto del propofol. Potencia los efectos depresores de los narcóticos, hipnóticos y anestésicos volátiles, así como el bloqueo neuromuscular de los relajantes no despolarizantes.
- *Consideraciones:* requiere monitorizar ECG, TA y O_2. Se debe diluir en SG5% a una concentración máxima de 2 mg/ml. El dolor local de la inyección se reduce con el empleo de lidocaína. En los ancianos se debe reducir la dosis un 20%.
- *Conservación:* temperatura ambiente.

2.1.5. Tiopental

- *Presentación:* vial de 500 o 1.000 mg en polvo.
- *Nombre comercial:* Tiobarbital®.

- *Vías de administración:* IV.
- *Farmacología:* barbitúrico de acción rápida y vida media ultracorta con efecto depresor sobre los receptores centrales GABA y AC. Disminuye el flujo cerebral, consumo de O_2, PIC y PIO.
- *Indicaciones:* inducción anestésica en pacientes HD estables o con TCE, procesos anestésicos cortos, HTIC, estatus convulsivo.
- *Farmacocinética:* inicio de acción IV en 15 segundos con pico en 30-60 segundos y duración de 5-15 min. Metabolismo hepático. Eliminación renal.
- *Dosis:* en adultos para inducir la anestesia bolo inicial IV de 3-5 mg/kg al 2,5% (diluir 500 mg en 20 ml de SF para una concentración de 25 mg/ml) en 30-60 segundos, mantenible con bolos del 50% de la dosis inicial o perfusión a 0,1-0,5 mg/kg/min

(0,24-1,20 ml/kg/hora de una dilución al 2,5%); en status 0,5-2 mg/kg; para reducir la PIC 1-3 mg/kg. En niños 2-6 mg/kg.

- *Efectos secundarios:* bradicardia, hipotensión, ICC, sialorrea, broncoespasmo, laringoespasmo, apnea, hipoventilación, rash, prurito, cefalea, delirio, somnolencia, náuseas, vómitos, porfiria, tromboflebitis, gangrena, necrosis, dependencia, tolerancia, liberación de histamina.
- *Sobredosis:* no existe antídoto específico; tratamiento sintomático con medidas que incluyen el soporte respiratorio y el control de la temperatura corporal. Puede dializarse para aumentar la eliminación.
- *Contraindicaciones:* hipersensibilidad, crisis asmática, liberación de histamina, taquiarritmia, porfiria, miastenia gravis, intoxicación por alcohol, somníferos, analgésicos o psicofármacos.

- *Embarazo:* categoría FDA-C.
- *Interacciones:* reduce la acción de los anticoagulantes, β-bloqueantes, digoxina, griseofulvina, AHC, fenitoína, fitomenadiona, quinidina y corticoides, mientras que aumenta la de IMAOS, cloranfenicol, alcohol y antihistamínicos. Se ve potenciado por fenotiacinas y ácido valproico; así como se antagoniza con aminofilina.
- *Consideraciones:* requiere monitorizar ECG, TA y O_2. Debe diluirse con API o SF. No tiene acción analgésica. En caso de extravasación se puede producir necrosis local. Es neuroprotector ante una isquemia focal. No puede mezclarse con los relajantes musculares, porque precipita.
- *Conservación:* temperatura ambiente.

FORMACIÓN ALCALÁ

2.2. Sedantes

2.2.1. Morfina

- *Presentación:* ampolla de 10 mg en 1 ml o 20 mg en 1 ml.
- *Nombre comercial:* Cloruro mórfico®.
- *Vías de administración:* IV-IM-SC.
- *Farmacología:* opioide mayor con efecto analgésico por unión a los receptores opioides a nivel central e inhibición de la vía nociceptiva ascendente. También produce sedación.
- *Indicaciones:* dolor severo agudo y crónico, postquirúrgico, torácico asociado al IAM, disnea por insuficiencia ventricular izquierda y EAP, ansiedad asociada al dolor, preanestesia.
- *Farmacocinética:* inicio de acción IV en 1 min (SC 15-30 min) con pico en 5-20 min

(SC 50-90 min) y duración de 2-7 horas. Metabolismo hepático. Eliminación renal y fecal.

- *Dosis:* en adultos dosis inicial de 2-15 mg en bolo IV de 1-3 mg diluido en 10 ml de SF repetible cada 5 min, pudiéndose implementar una perfusión continua a 1-80 mg/hora; en niños la dosis terapéutica es 0,05-0,2 mg/kg cada 3-4 horas; máximo 15 mg diarios.
- *Efectos secundarios:* depresión respiratoria, bradipnea, inhibición del reflejo tusígeno, náuseas, vómitos, estreñimiento, retención urinaria, somnolencia, desorientación, diaforesis, hipotensión, bradicardia, tolerancia, dependencia, miosis, cefalea, temblor, convulsiones, alucinaciones, xerostomía, calambres abdominales, visión borrosa, prurito.
- *Sobredosis:* el antídoto es la naloxona.

- *Contraindicaciones:* hipersensibilidad, HTIC, shock, depresión central, cardiaca o respiratoria, crisis asmática, íleo paralítico. Debe restringirse su uso en el embarazo y la lactancia, ya que puede producir dependencia física en el feto o recién nacido.
- *Embarazo:* categoría FDA-C.
- *Interacciones:* reduce el efecto de los diuréticos. Se potencia junto a otros depresores centrales y dextroanfetamina. No debe asociarse con IMAOS y petidina.
- *Consideraciones:* requiere monitorizar ECG, TA y O_2. Es preciso vigilar el nivel de consciencia. Debe administrarse individualmente.
- *Conservación:* temperatura ambiente, protegido de la luz.

FORMACIÓN ALCALÁ