



T24.- ANSIOLÍTICOS E HIPNÓTICOS

1. DEFINICIONES

Son fármacos depresores del SNC

1.1. Hipnóticos: Inductores del sueño

1.2. Ansiolíticos: Mejoran la ansiedad sin producir sedación o sueño

2. INSOMNIO Y ANSIEDAD

2.1. Insomnio: Dificultad para conciliar el sueño: Incapacidad para permanecer dormido. Periodos de sueño breve con sensación de no haber descansado. Usualmente las tres características aparecen conjuntamente (recordar fases del sueño normal: REM y No-REM)

2.2. Ansiedad: *Síntomas psíquicos:* temor, zozobra, amenaza de algo desconocido, angustia, irritabilidad, pérdida de autoestima, de la capacidad de concentración. *Síntomas somáticos:* palpitaciones, temblor, tensión muscular, sudoración, náuseas

3. CLASIFICACIÓN

3.1. Benzodiazepinas de acción corta: *triazolan, oxacepan. De acción intermedia:* *bromacepan, temacepan. De acción larga:* *diacepan, fluracepan, clordiazepóxido*

3.2. Agonistas de receptores 5-HT_{1A}: *buspirona*

3.3. Antagonistas de receptores beta: *propranolol*

3.4. Otros: *barbitúricos, clormetiazol, antihistamínicos*

4. BENZODIAZEPINAS. Son hipnóticos y ansiolíticos de elección.

4.1. Todos los miembros del grupo se comportan como ansiolíticos e hipnóticos en dosis adecuadas.

4.2. Acciones farmacológicas hipnótica, sedante, ansiolítica, relajante muscular, antiepiléptica, anticonvulsivante

5. MECANISMO DE ACCIÓN.

Inhibición de la neurotransmisión gabaérgica (receptores GABA_A) favoreciendo la apertura del canal de Cl⁻ y su conductancia por el anión cloruro. Los barbitúricos actúan a distinto nivel en el receptor para GABA con las mismas consecuencias.

6. FARMACOCINÉTICA.

Son muy liposolubles y ello condiciona su llegada y acción a nivel del sistema nervioso central. Muchos de ellos dan lugar a metabolitos activos de muy larga duración ($T_{1/2}$ de diacepan 30-60 h; $T_{1/2}$ de desmetildiacepan, su metabolito, 200 h) El metabolismo tiene lugar en el hígado. Las benzodiazepinas difieren en forma importante en su vida media y, dependiendo de ella, se utilizan clínicamente o como hipnóticos o como ansiolíticos. Eliminación renal.

7. EFECTOS ADVERSOS.

Depresión del SNC, del estado de alerta, amnesia, somnolencia y a veces reacciones paradójicas (agitación). Depresión respiratoria leve. Bajo potencial suicida. No deben manejarse herramientas peligrosas ni conducir vehículos bajo su acción.

8. VENTAJAS:

Son muy poco tóxicas. No inducen los enzimas microsomales. La tolerancia y dependencia es menor que con otros hipnótico-ansiolíticos (léase barbitúricos), pero existe.

9. INTERACCIONES.

Potencian los efectos de otros depresores del SNC, del alcohol y algunos antihistamínicos.

10. APLICACIONES CLÍNICAS.

Ansiedad, insomnio, inducción de la anestesia, distonías musculares, epilepsia.

11. ANSIOLÍTICOS NO BENZODIACEPÍNICOS.

11.1. Barbitúricos. Hoy día son poco utilizados. Peligro de intoxicación grave. Tolerancia y dependencia. Inducen enzimas microsomales y, en consecuencia, producen muchas interacciones. Les queda su utilidad como antiepilépticos, a dosis subhipnóticas, y para tratar la hiperbilirrubinemia del recién nacido.

11.2. Fármacos que actúan a nivel de los receptores serotoninérgicos (5HT_{1A}).
Buspirona. No tiene propiedades sedantes ni hipnóticas. Se comporta como ansiolítico. Actúa a nivel de los receptores 5HT_{1A} de las terminaciones sinápticas de los núcleos del rafe, disminuyendo la liberación de serotonina. Pero requieren al menos dos semanas para ejercer su efecto ansiolítico.

11.3. Bloqueantes de receptores beta: Mejoran o alivian los síntomas neurovegetativos que acompañan a la ansiedad: temblor, palpitaciones, sudoración y diarrea. Prototipo: propranolol

11.4. Otros. *Clorometiazol.* No tiene ventajas sobre las benzodiazepinas. Causa dependencia y debe utilizarse por periodos breves. *Hidrato de cloral,* sin ventajas.