

COCAÍNA

Se obtiene de la hoja de la planta Erithroxylon Coca.

Fue el **primer anestésico local** utilizado en clínica. A partir de él se sintetizaron numerosos compuestos, el primero de los cuales fue la **procaina** en 1905. Todos sus derivados tienen en común esta propiedad anestésica ya que producen una **disminución de la permeabilidad en las membranas al ion sodio** por lo que produce un **bloqueo de la conducción nerviosa**.

El consumo de cocaína varía según la cantidad, ritmo y vía posible de combinación con otras sustancias:

1. Según la cantidad:

- **Consumo controlado:** normalmente experimental o recreativo, con cantidades moderadas y con control voluntario de consumo.
- **Consumo intensificado:** abuso y dependencia de cocaína, no se tiene integridad voluntaria para dejar de consumir.

2. Según la vía:

- **Oral:** de hojas frescas de la planta de coca masticadas.
- **Nasal:** inhalación de clorhidrato de cocaína pulverizada mediante un tubo hueco.
- **Aspiración fumada** de pasta de coca o aspiración de base libre fabricada a partir de clorhidrato. El efecto por esta vía es rápido e intenso.
- **Intravenosa:** clorhidrato de cocaína disuelto en agua.
- **Otras:** rectal, genital,...

3. Según la mezcla:

- **Cocaína pura**
- **Cocaína mezclada** con alcohol, cannabis, heroína,...

FARMACOCINÉTICA

La cocaína es una base débil que atraviesa rápidamente las membranas corporales. De su forma de presentación y de la vía utilizada dependerá el tiempo de acción, el pico máximo, la biodisponibilidad, la duración del efecto, etc.

Presentación	Vía	Tiempo de acción	Pico de efecto máximo	Duración del efecto	Biodisponibilidad (%)
Hoja de coca (mascada)	oral	5-10'	45-90'	—	—
Clorhidrato	oral	10-30'	—	60'	20-30
	inhalada intranasal	2-3'	15-30'	45-60'	20-30
	intravenosa	30-45"	10-20'		100
Pasta de coca	fumada (intrapulmonar)	8-10"	5-10'		6-32
Base	aspirada intrapulmonar				90-100

MECANISMO DE ACCIÓN

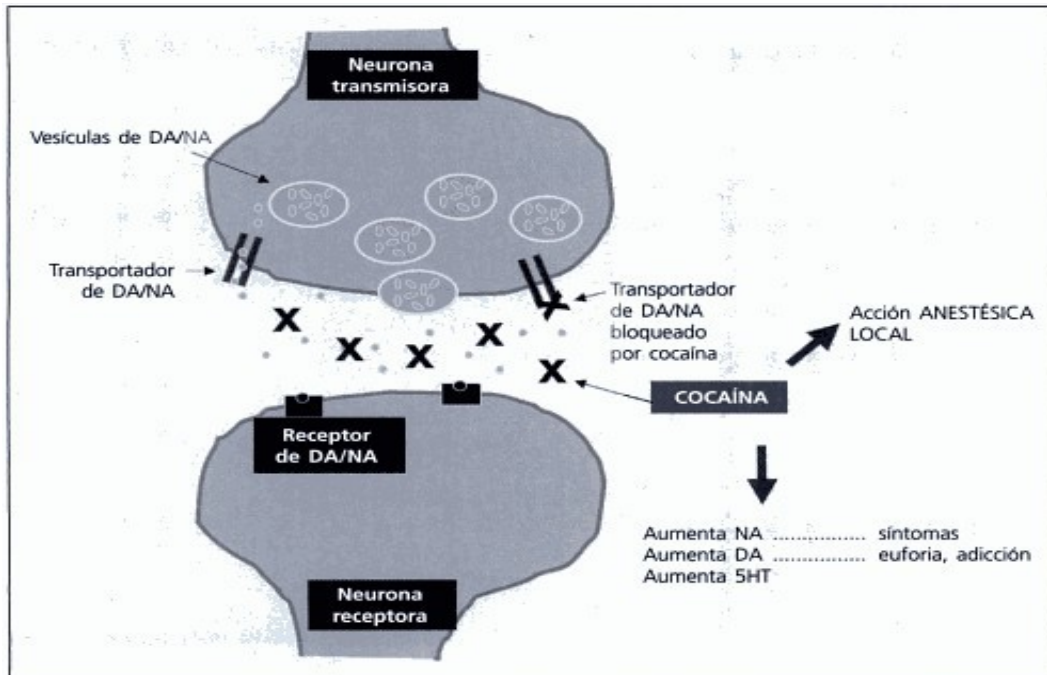
La cocaína se comporta como una amina simpaticomimética de acción indirecta. Es un inhibidor de los procesos de recaptación tipo 1 (recaptación de noradrenalina y dopamina desde la hendidura sináptica a la terminal presináptica) por lo que facilita la acumulación de estas en la hendidura.

Al aumentar la disponibilidad de dopamina se produce un aumento de euforia. Si el consumo de cocaína se hace crónico se producirán cambios en la disponibilidad de dopamina. El transportador de la recaptación de dopamina es necesario para que se produzca la acción farmacológica de la cocaína ya que al hacerse estudios en ratones deficientes en este transportador la cocaína no ejerce efectos conductuales ni bioquímicos.

El exceso de noradrenalina es el responsable de la mayoría de los efectos y complicaciones agudas de la cocaína como pueden ser el aumento de la presión arterial, dilatación pupilar, sudoración, etc.

Además la cocaína bloquea la recaptación de serotonina.

Estos efectos sobre la neurotransmisión catecolaminérgica y serotoninérgica constituyen la base de su dependencia.



ACCIONES FARMACOLÓGICAS

1- Sistema nervioso simpático y aparato cardiovascular: estimula receptores alfa y beta adrenergicos.

- Vasoconstricción
- Aumento de la presión arterial
- Bradicardia a dosis bajas y taquicardia a dosis altas
- Midriasis, sudor y temblor.

2- Temperatura corporal: aumenta.

- Producción de calor por aumento de la actividad muscular.
- Disminución de pérdida de calor por vasoconstricción
- Pérdida de control central dopaminérgico.

3- Sistema nervioso central: potente estimulante.

- Elevación del estado de ánimo
- Disminución de apetito y sensación de fatiga
- Insomnio
- Hiperactividad motora y verbal

INTOXICACIÓN

El cuadro de intoxicación por cocaína no complicada produce excitación, intranquilidad, incoherencia del lenguaje, taquicardia, midriasis, hipertensión, náuseas, temblor, sudoración, hipertermia, y a veces, arritmias, dolor torácico, movimientos estereotipados y distonías.

Los efectos más graves suelen producirse por consumo prolongado y de grandes cantidades, pudiendo llegar a producir colapso, convulsiones, coma, parada respiratoria y muerte.

El efecto psicológico más claro es la euforia que dependiendo de las circunstancias puede asociarse a ansiedad, irritabilidad, disforia, grandiosidad, deterioro de juicio, incremento de la actividad psicomotriz e hipervigilancia.

Los **criterios** que se deben de cumplir para reconocer una intoxicación aguda de cualquier sustancia psicoactiva son:

- Evidencia de consumo reciente de una sustancia psicoactiva en dosis lo suficientemente elevadas como para dar lugar a una intoxicación.
- Tiene que haber síntomas o signos relacionados con la sustancia que se ha consumido
- Estos síntomas y signos no deben de poder ser explicados por una enfermedad medica no relacionada con el consumo de esta sustancia o por otro trastorno mental o de comportamiento.

Los siguientes criterios son **específicos** de la intoxicación aguda por cocaína:

- Debe existir un comportamiento alterado o anormalidades perceptivas que incluyan alguno de los siguientes: euforia, hipervigilancia, creencia o actos de grandiosidad, agresividad, beligerancia verbal, labilidad del humor, conductas estereotipadas, ilusiones, alucinaciones...
- Deben de presentarse al menos 2 de los siguientes signos: taquicardia, arritmia, hipertensión, sudoración y escalofríos, náuseas y vómitos, pérdida de peso, dilatación pupilar, debilidad muscular, dolor torácico, convulsiones.

DEPENDENCIA

El consumo abusivo y dependiente de la cocaína se asocia a los siguientes patrones:

1-Vía de administración: el consumo de base libre y de clorhidrato intravenoso son los más adictivos. En España, la mayoría de los pacientes consumen clorhidrato por vía intranasal.

2-Tiempo de consumo y dosis: a mayor tiempo y más cantidad consumida aumenta la posibilidad de que se cree una dependencia.

3- Tendencia a la compulsión y a la aparición de movimientos estereotipados: los individuos que presentan estas conductas al tomar cocaína, tienen más posibilidades de crear una adicción.

La **clínica** de la dependencia de cocaína se caracteriza por:

- Pérdida de control sobre el consumo. Autodestrucción.
- Complicaciones graves debidas al consumo. Estas pueden ser muy variadas: médicas, sociales, familiares, económicas, etc.
- Negación de la enfermedad
- Pérdida de las sensaciones placenteras que el paciente percibía al comenzar a tomar cocaína.
- Aparición de apetencia intensa de cocaína.
- Fenómenos de tolerancia inversa (pequeñas cantidades de cocaína produce efectos

- importantes)
- Alteración de las funciones ejecutivas y de motivación.
 - Trastornos cognitivos y psicosis
 - Trastornos en la alimentación y el sueño

SINDROME DE ABSTINENCIA

Se observa en pacientes a las pocas horas o días de dejar de consumir o disminuir la cantidad de consumo. Suele durar varios días. Sus síntomas son disforia, fatiga, alteración de la cantidad de sueño, incremento del apetito, retardo o agitación psicomotriz, etc. Durante este periodo aumenta el riesgo suicida del paciente.

El cocainómano no busca necesariamente el consumo de cocaína durante el periodo de abstinencia y puede que el consumo de esta no alivie sus síntomas, sino complicarlos.

En este periodo podemos ver diferentes **fases**:

- 1. Abatimiento o crash:** se caracteriza por anergia intensa, hiperfagia, somnolencia e incremento del sueño total y REM durante 2 o 3 días después del consumo.
- 2. Abstinencia:** con síntomas depresivos mayores, anhedonia y anergia de semanas o meses de duración.
- 3. Extinción:** apetencia incluso tras meses de abstinencia ante estímulos que evocan euforia cocaínica.

TRASTORNOS PSIQUIÁTRICOS

Psicosis cocaínica: una de las consecuencias psiquiátricas. Se presenta más frecuentemente en consumidores de base e inyectores y puede cursar con agresividad y agitación. Aproximadamente entre el 65-70% de los consumidores crónicos de cocaína presentan síntomas paranoides transitorios que se suelen resolver tras las 24- 48 horas de abstinencia. Otros consumidores crónicos de grandes cantidades no experimentan nunca síntomas psicóticos. Esto nos hace pensar que existe algún componente de predisposición genética en la base de esta psicosis. La psicosis puede ser leve, moderada o grave en función de los síntomas, como afecta al pensamiento, la percepción y la motilidad.

	LEVE (30%)	MODERADA (16%)	GRAVE (9%)
<i>Frecuencia</i>	Ocasional	>50%	Siempre o casi siempre
<i>Pensamiento</i>	Susplicacia	Ideas delirantes leves y/o transitorias	Ideas delirantes graves y/o persistentes
<i>Percepción</i>	Ilusiones, alucinaciones ocasionales poco importantes	Alucinaciones de un tipo, no determinan la conducta	Alucinaciones de más de un tipo, o que determinan la conducta
<i>Motilidad</i>	Estereotipias ausentes o leves	Estereotipias notorias y/o subagitación psicomotriz	Estereotipias graves y/o agitación psicomotriz

La aparición de la psicosis suele ir precedida de un periodo en el que el paciente se muestra disfórico y suspicaz y presenta conductas compulsivas. Luego aparecen ideas delirantes de persecución, perjuicio, celos...(conductas de autoprotección).

El tratamiento de la psicosis con neurolépticos puede ser peligroso y no suele ser necesario si conseguimos que el paciente se mantenga sin consumir.

Otros trastornos psiquiátricos producidos por la cocaína además de la psicosis son:

- Trastornos afectivos
- Alcoholismo y otras adicciones
- Trastornos de ansiedad
- Deficit de atención
- Trastornos del control de los impulsos, trastornos de personalidad, estados disociativos, alteraciones cognitivas, disfunciones sexuales,etc.

COMPLICACIONES ORGÁNICAS

1. Intoxicación

2. Alteraciones otorrinolaringológicas: en la mucosa nasal debido al efecto vasoconstrictor de la cocaína. La mucosa presenta inflamación, úlceras, que a la larga se puede convertir en necrosis y perforación del tabique.

3. Cardiovasculares: la toxicidad cardiovascular es la principal causa de mortalidad asociada al consumo de cocaína. El riesgo de infarto de miocardio durante el consumo aumenta 24 veces.

4. Accidentes cerebrovasculares: infarto cerebral, hemorragia subaracnoidea, hemorragia intraparenquimatosa e intraventricular. Suceden por el incremento brusco de presión arterial tras la liberación adrenérgica que produce la cocaína.

5. Alteraciones neurológicas: cefalea intensa, temblor, vértigo, visión borrosa, ataxia y síncope. También se pueden ver cuadros más graves como accidentes cerebrovasculares, crisis convulsivas, encefalopatía tóxica y hemorragia cerebral.

6. Pulmonares: la cocaína dificulta la difusión de oxígeno al torrente sanguíneo por efectos vasoconstrictores. Da lugar a neumonía con fuerte dolor torácico, fiebre y disnea. El tratamiento debe hacerse con antiinflamatorios y oxígeno.

7. Alteraciones ginecológicas y obstétricas: puede poner en riesgo a la madre y al feto. Al producirse hipertensión arterial se incrementa la resistencia vascular uterina disminuyendo el flujo placentario. Los efectos sobre el feto son: bajo peso al nacer, menor perímetro cefálico, alteraciones genitourinarias y cardíacas, etc..

8. Alteraciones sexuales: aunque la cocaína inicialmente pueda aumentar la excitación sexual, a largo plazo se produce una disminución marcada de la libido fuera de los periodos de consumo, impotencia y ginecomastia en el varón y anorgasmia en la mujer.

9. Renales: fallo renal agudo.

10. Digestivas: hepatotoxicidad, náusea, dolor abdominal, anorexia, etc.