Posicionamiento actual de los Betabloqueantes

- Los betabloqueantes son antagonistas competitivos de los receptores beta-adrenérgicos; no obstante, no se comportan como un grupo único de fármacos y se reconocen diferencias relevantes entre las distintas moléculas.[1]
- Estas diferencias se relacionan con sus efectos específicos sobre los receptores beta-adrenérgicos y por la existencia de mecanismos complementarios de acción. [1]

Afinidad selectiva sobre los distintos subtipos de receptores.	**Los diversos betabloqueantes muestran una afinidad distinta** por cada uno de los subtipos de receptores, lo que resulta en un perfil farmacológico específico.
Efectos diferentes del antagonismo de los receptores β.	**Agonismo inverso:** algunos betabloqueantes pueden adoptar conformaciones moleculares que activan vías de señalización. **Agonismo parcial:** algunos betabloqueantes pueden ejercer actividad antagonistas sobre el receptor beta-1 y efecto agonista sobre otros subtipos.
Mecanismos adicionales de acción.	Algunos betabloqueantes pueden ejercer efectos adicionales a su actividad sobre los recetores beta, que incluyen: **Bloqueo de los canales de potasio** **Liberación de óxido nítrico**

- Como consecuencia y en función fundamentalmente de las diferencias de actividad sobre los subtipos de receptores β1 y β2, los betabloqueantes pueden clasificarse en:

	Actividad vasodilatadora	Fármaco	Mecanismos complementarios
β1 y β2 selectivos	Ausente	Alprenolol	
		Bupranolol	
		Nadolol	
		Orprendol	
		Pindolol	
		Propranolol	
		Sotalol	Acción sobre los canales de potasio
		Timolol	
	Presente	Carvedilol	Antagonista alfa-1, liberación de óxido nítrico
		Labetalol	Antagonista alfa-1

	Actividad vasodilatadora	Fármaco	Mecanismos complementarios
β1 selectivos	Ausente	Atenolol	
		Betaxolol	
		Bisoprolol	
		Metoprolol	Efectos sobre el receptor alfa-2
	Presente	Nebivolol	

Estas características permiten reconocer indicaciones cardiovasculares diferenciadas para cada uno de los betabloqueantes:

	β1 y β2 selectivos		β1 selectivos	
	Sin actividad vasodilatadora	Con actividad vasodilatadora	Sin actividad vasodilatadora	Con actividad vasodilatadora
Insuficiencia cardíaca		Carvedilol	Bisoprolol Metoprolol	Nebivolol
Hipertensión	Propranolol Nadolol	Carvedilol Labetalol	Atenolol Bisoprolol Metoprolol	Nebivolol
Hipertensión ocular	Timolol		Betxolol	
Cardiopatía isquémica	Propranolol Nadolol	Carvedilol	Atenolol Bisoprolol Metoprolol	Celiprolol

	β1 y β2 selectivos	β1 selectivos
Arritmias	Propranolol Nadolol Sotalol	Atenolol Metoprolol

En el caso de la insuficiencia cardíaca, se considera a los betabloqueantes un pilar fundamental del tratamiento en los estadios avanzados, en forma independiente de la capacidad funcional. Se priorizan aquellos con eficacia demostrado en estudios clínicos, como el carvedilol.

En los pacientes con hipertensión arterial (HTA), los betabloqueantes se reconocen como indicación recomendada en situaciones específicas:3

- HTA asociada a enfermedad coronaria (clase I, nivel de evidencia A)
- HTA asociada a insuficiencia cardíaca o disfunción sistólica ventricular izquierda (clase I, nivel de evidencia A)
- HTA asociada a fibrilación auricular (clase I, nivel de evidencia A)
- HTA en pacientes con migraña (propanolol, clase I, nivel de evidencia C)
- HTA gestacional (labetalol, clase I, nivel de evidencia B)
- HTA y crisis hipertiroidea (clase I, nivel de evidencia C)
- HTA asociada a hiperactividad simpática (clase IIa, nivel de evidencia C)

Los betabloqueantes constituyen uno de los grupos de fármacos más útiles en la práctica clínica; a medida que se conocen sus mecanismos de acción intracelulares específicos, mayor es el número de sus potenciales aplicaciones en el tratamiento. Estos fármacos deben entenderse como moléculas individuales y no como un grupo homogéneo de moléculas con una acción terapéutica común.1

Referencias:

[1] Oliver E, Mayor Jr F, D’Ocon P. Bloqueadores beta: perspectiva histórica y mecanismos de acción. Rev Esp Cardiol. 2019; 72(10): 853–62.

[2] Sociedad Chilena de Cardiología y Cirugía Cardiovascular y Ministerio de Salud. Guía Clínica: Insuficiencia Cardíaca, 2015.

[3] Sociedad Argentina de Cardiología. Federación Argentina de Cardiología. Sociedad Argentina de Hipertensión Arterial. Consenso Argentino de Hipertensión Arterial. Rev Arg Cardiol. 2018; 86(Supp 2): 1-56.

R1284222-CH-CO-20082024-0850

Material para uso exclusivo de los profesionales de la salud.