

QUIMIOTERAPIA DE LA PARASITOSIS

ANTIPARASITARIOS ANTIPROTOZOARIOS
Y ANTIHELMINTICOS

CARACTERISTICAS GENERALES

PROTOZOOS

- Organismos unicelulares
- Multiplicación directa en el huésped (asexuada)
- Parásitos intra o extracelulares

HELMINTOS

- Organismos multicelulares
- No se multiplican directamente en los humanos (reproducción sexual)
- Parásitos extracelulares

ANTIPROTOZOARIOS NITROIMIDAZOLES

CLASIFICACIÓN – INDICACIÓN

- **METRONIDAZOL:**
disentería amebiana, giardiasis, amebiasis invasiva, tricomoniasis
- **TINIDAZOL:** disenteria amebiana, giardiasis, amebiasis invasiva, tricomoniasis
- **ORNIDAZOL:** disenteria amebiana, amebiasis
- **SECNIDAZOL:** disenteria amebiana, amebiasis

METRONIDAZOL

- **Espectro antiparasitario:** Entamoeba histolytica, Giardia lamblia y Trichomonas vaginalis.
- **Espectro antimicrobiano:** cocos anaerobios y bacilos gramnegativos anaerobios. B.fragilis, Clostridium, Fusobacterium, Peptococcus, Helicobacter y Peptoestrepococcus.

METRONIDAZOL

MECANISMO DE ACCIÓN

- Profármaco activado en el interior de células sensibles reduciendo su grupo nitro por la enzima ferredoxina del parásito, formando un compuesto reactivo que interfiere en el transporte de electrones y rompe el DNA.

EFFECTOS ADVERSOS

- Frecuentes: cefalea, náuseas, boca seca, sabor metálico
- Pocos frecuentes: vómitos, diarrea, insomnio, debilidad, mareos, estomatitis, disuria, orina oscura, vértigo, ataxia, leucopenia. (por vía e.v. puede dar convulsiones o neuropatía periférica)

METRONIDAZOL

PRECAUCIONES --CONTRAINDICACIONES

- Potencia el efecto de la warfarina (inhibe el metabolismo)
- Intolerancia al alcohol por inhibición de la aldehído deshidrogenasa (antabús)
- Evitar 1º trimestre embarazo, en casos de lactancia suspender h/24 hs después
- Evitar en pacientes con alteraciones neurológicas, renales o hepáticas.

METRONIDAZOL: INDICACIONES

AMEBIASIS

- Adultos: 750 mg (3 tomas diarias), durante 10 días.
- Niños: dosis de 30-50 mg/k/3 tomas/ 10 días.

TRICHOMONIASIS VAGINALIS

- 2 g/oral/1 sola dosis o 250 mg/8 hs/ 7 días.

GIARDIASIS

- Adultos: 750 mg/d en 3 dosis/ 7-14 días
- Niños: 45mg/k/d divididos en 3 tomas, 7 - 14 días.

AMEBICIDAS LUMINALES

PAROMOMICINA

- 500 mg 3 veces al día durante 10 días

DILOXANIDA

- 500 mg 3 veces al día durante 10 días

YODOQUINOL

- 650 mg 3 veces / día durante 20 días

HELMINTOS: CLASIFICACIÓN GENERAL

Familia de los Nematelmintos (“cilíndricos”)

- **Nematodos:**
- ascariasis, oxiuriasis, necatoriasis, toxocariasis, ancylostoma

Familia de los Platelmintos (“planos”)

- **Cestodos:** teniasis, himenolipiasis
- **Trematodos:** difilobotriasis, schistosomiasis

MEDICAMENTOS ESENCIALES OMS

- Antihelminfos:
Albendazol, Levamisol, Mebendazol, Niclosamida
Praziquantel, Pirantel pamoato
- Antitrematodos y antiesquistosomas
Praziquantel, Triclabendazol
- Antifilariasis
Dietilcarbamazina, Ivermectina

PIRANTEL

MECANISMO DE ACCIÓN

- a) Activación persistente del Receptor nicotínico excitatorio de Acetilcolina del músculo de nemátodos, despolarización y PARÁLISIS ESPÁSTICA por incremento de la conductancia al sodio y al potasio
- b) Inhibe la colinesterasa

FARMACOCINÉTICA

- poca absorción oral, eliminación por heces excreción urinaria (inalterado + metabolitos)
- USOS: Enterobiasis, ascariasis, Uncinariasis

PIRANTEL

EFFECTOS ADVERSOS:

- Gastrointestinales, cefaleas, fiebre, mareos.
- No hay pruebas de que sea inofensivo para el embarazo o el lactante

CONTRAINDICACIONES:

- Menores de dos años, Embarazo

PRAZIQUANTEL

Mecanismo de acción:

↑ permeabilidad de la membrana al calcio → contracción marcada → Parálisis muscular Vacuolización y desintegración del tegumento

• **Espectro:**

Platelmintos (Ascaris, Trichuris, Ancylostoma, Necator)

Farmacocinética

Absorción rápida por vía oral, metabolismo hepático

Excreción urinaria (70%) biliar (30%)

PRAZICUANTEL

TOXICIDAD

Trastornos GI, cefalea, mareo, lasitud, fiebre, rash, prurito
No hay evidencias de mutagénesis o carcinogénesis

INDICACIONES

- Taenia solium (sulfato de magnesio para eliminar los segmentos maduros)
- Taenia saginata
- Himenolepis nana
- Neurocisticercosis (con prednisona)

PRAZICUANTEL

EFFECTOS INDESEABLES:

gastrointestinales, somnolencia, exantemas, eosinofilia
Neurocisticercosis puede ocasionar exacerbaciones
neurológicas por reacción inflamatoria alrededor de los
parásitos muertos

CONTRAINDICADO

Cisticercosis ocular

INTERACCIONES

- corticoides ↓ los niveles plasmáticos
- antagonismo con digoxina

IVERMECTINA

MECANISMO DE ACCIÓN

- Ocasiona parálisis por activación de un canal de cloro (abierto por glutamato) generando hiperpolarización y parálisis tónica. También activa canales de cloro sensibles al GABA en nematodos.

FARMACOCINÉTICA

- Administración oral, subcutánea, tópica. Alta distribución en la grasa y el hígado. Eliminación por heces.
- **Usos:** Oncocercosis, filariasis, Estrongiloidiasis, escabiosis, pediculosis

CESTODOS: TENIASIS

NICLOSAMIDA

- Adultos: 2 g en dosis única. Masticar los comprimidos
- Niños: (11-34 kg): 1 g en dosis única. Más de 34 Kg: 1.5g en dosis única

PRAZIQUANTEL

- Adultos-Niños: 10-20 mg/kg en una toma

CESTODOS: HYMENOLEPIASIS

PRAZIQUANTEL

- Adultos-Niños: 25 mg/kg en una toma

NICLOSAMIDA (alternativa)

- Adultos: 2g el 1º día, después 1 g/día durante 6 días. Masticar los comprimidos.
- Niños: (11-34 Kg): 1g + 0.5 g/día durante 6 días. Más de 34 Kg: 1.5 g+1g/día durante 6 días

TRATAMIENTOS DE ELECCIÓN

ASCARIASIS

- Mebendazol 100mg c/12 hs / 3días
- Albendazol 400 mg única vez
- Pirantel dosis única de 10 mg/kg

TRICHURIASIS

- Mebendazol 100 mg c/12 hs / 3días
- Albendazol 400 mg única vez
- Flubendazol 100 mg / 3 días

TRATAMIENTOS DE ELECCIÓN

- Tratamientos de Elección

OXIURIASIS

- Mebendazol 100 mg única dosis
- Albendazol 400 mg única vez
- Pirantel dosis única de 10 mg /kg (máximo 1 gr)

TENIASIS

- Mebendazol 200 mg c/12 hs / 4días

MECANISMO DE ACCION

- 1- Canales iónicos de membrana del parasito
 - A) Receptor nicotínico excitatorio de la acetilcolina: levamisol, pirantel
 - B) Canal receptor inhibitorio del GABA: piperazina
 - C) Canal de cloro abierto por glutamato: ivermectina
 - D) Canales de calcio: praziquantel

MECANISMO DE ACCION

2. Sobre Blancos Bioquímicos del parásito actuando más lentamente

A. β -tubulina en nemátodos: albendazol, mebendazol

B. Ionóforos protones: niclosamida

C. Metabolismo del ácido fólico: pirimetamina

BENZIMIDAZOLES: ALBENDAZOL MEBENDAZOL - TIABENDAZOL

- **Mecanismo de acción:**
 - Unión a la beta tubulina con polimerización de microtúbulos con pérdidas de vesículas secretorias y alteración de la captación de glucosa (larvas/adultos)
- Otros: inhibición de la fumarato reductasa, desacoplamiento de la fosforilación oxidativa
- **Espectro:**
 - Ascaris, Ancylostoma, Necator, Trichuris

MEBENDAZOL - ALBENDAZOL

- **Farmacocinética:**
 - Absorción rápida, pero incompleta (baja biodisponibilidad; efecto de primer paso) Absorción oral, mejor con alimentos
- Metabolitos poco activos (excepto albendazol)
Metabolismo Hepático, Sulfóxido albendazol (activo)
- Distribución SNC
- Excreción biliar: mebendazol Renal: albendazol
- **Toxicidad:** Trastornos GI Fiebre, rash, eritema
Gastrointestinales, citopenias, colestasis, teratógenésis, embriotoxicidad

MEBENDAZOL

- **Efectos adversos:** en casos de infestación masiva y eliminación de vermes, puede producir dolor abdominal y diarrea. En tratamientos prolongados pueden producir ↑ transaminasas, supresión de medula ósea y alopecia.
- **Interacciones:** puede reducir niveles de ácido valproico y carbamacepina.
- **Contraindicaciones:** embarazo (produce teratogénesis en animales) y en alérgicos. No usar en menores de 2 años.

MEBENDAZOL-ALBENDAZOL

USOS TERAPÉUTICOS

- Amplio espectro: Uncinariasis, Ascaridiasis, Tricocefalosis, Estrongiloidiasis, Enterobiasis u Oxiuriasis, Teniasis, Neurocisticercosis

CONTRAINDICACIONES

- Encefalitis cisticercósica, Hipertensión Endocraneana. Cirrosis

MEBENDAZOL

- **Dosis:** Vía Oral.
- Adultos y niños mayores de 2 años: 100 mg para enterobiasis (única dosis); 100 mg cada 12 hs durante 3 días en ascariasis, trichuriasis y uncinariasis. Repetir a las 2-3 semanas, evita las reinfecciones.

LARVA MIGRANS VISCERAL

100-200 cada 12 horas durante 5 días.

TRIQUINOSIS

- 5 mg/kg cada 8 horas durante 10-14 días.

NEMATODOS INTESTINALES

ASCARIASIS

- Mebendazol Adultos-Niños: 100 mg 2/veces/día durante 3 días.
- Albendazol Adultos-Niños: 400mg en toma única
- *Pirantel pamoato (alternativo)* Adultos-Niños: 11 mg/kg (máx. 1 g) en toma única.

NEMATODOS INTESTINALES

ENTEROBIASIS

(en cualquier caso repetir a las 2 semanas)

- Mebendazol Adultos-Niños: dosis única 100 mg
- Albendazol Adultos-Niños: dosis única 400 mg
- Pirantel pamoato (alternativa)
Adultos-Niños: 11mg/kg (máx.1g) en toma única

NEMATODOS INTESTINALES

TRICHURIASIS

- Albendazol Adultos-Niños: 400mg toma única.
- *Mebendazol (Altern)* Adultos-Niños: 100mg 2veces/día/3 días
- Flubendazol 100 mg /día 3 días

ESTRONGILOIDIASIS

- Albendazol 400 mg/día 3 días
- Ivermectina Adultos: 200 mcg/kg/día 1-2d
- *Tiabendazol (altern)* Adultos-Niños: 50mg/kg/día (máx. 3g/día) 2 tomas 2 días (7-10 días en enfermedad diseminada)

NEMATODOS INTESTINALES

LARVA MIGRANS CUTÁNEA

- Albendazol Adultos-Niños: 200 mg /3 día/
durante 3 días.
- Tiabendazol (aplicación tópica)