

CLASIFICACION QUÍMICA DE FARMACOS ANTIPSICÓTICOS-NEUROLÉPTICOS O TRANQUILIZANTES MAYORES

I- NEUROLÉPTICOS TRICÍCLICOS:

A) FENOTIAZINAS

Bimetilicas:

Clorpromazina (*Amplactil*)
 Levomepromazina (*Nozinan, Togatel*)
 Prometazina (*Fenergan*)

Acciones Sedativas

Piperazínicas

Trifluoperazina (*Stelazine*) (Esquizofrenia Crónica)

Piperidílicas

Tioridazina (*Meleril*)
 Propericiacina (*Neuleptil*)

Acciones Sedativas

B) DERIVADOS DE LOS TIOXANTENOS

Zuclopentixol (*Clopixol*)

C) DERIVADOS DIBENZODIACEPINAS

Clozapina (*Lapenax*)
 Clotiapina (*Etumina*)
 Olanzapina (*Midax; Zyprexa*)

CLASIFICACION QUÍMICA DE FARMACOS ANTIPSICÓTICOS-NEUROLÉPTICOS O TRANQUILIZANTES MAYORES

I- DERIVADOS DE LAS BUTIROFENONAS (Fenilbutilpiperidina):

Haloperidol (*Halopidol*)
 Bromperidol (*Bromodol*)
 Droperidol (*uso en anestesia general*)

Potentes acciones Antipsicóticas (alucinaciones-delirios)

II) DERIVADOS DE LA DIFENIL-BUTIL-PIPERIDINA:

Pimozida (*Orap 24*) VO 1 comp/d
 Fluspirileno (*Imap*) IM 1-2 sem
 Penfluridol (S.F.C.) VO 1-2 sem

Muy potentes Acción prolongada

III)-BENZAMIDAS SUSTITUIDAS

Sulpirida (*Vegestabil*) (*Hiperprolactinemia*)

IV- DERIV. BENZISOXAZOL

Risperidona (*Risperdal, Risperin*)
 Ziprazidone (*Zeldox*)

Aripiprazol (*Iraxem*)

Dra. Lorena Dos Santos- Cátedra de Farmacología

CLASIFICACION DE ANTIPSICÓTICOS SEGÚN SUS ACCIONES FARMACOLÓGICAS

a) Con marcadas acciones sedativas

* Clorpromazina (*Amplactil*)
 Levomepromazina (*Nozinan*)
 Clozapina (*Lapenax*)

SEDATIVOS

Hipotensión ortostática

b) Con menor acción sedativa y Potente acción antipsicótica:

* Haloperidol (*Halopidol*) cuadros agudos
 Bromperidol (*Bromodol*)
 Trifluoperazina (*Stelazine*) crónicos

Potentes acciones antipsicóticas

c) De transición: (comparten efectos sedativos y antipsicóticos)

Clozapina (*Etumina*)
 Tioridazina (*Meleril*) ancianos
 Risperidona (*Risperdal*)

Reacciones extrapiramidales

d) De depósito:

Haloperidol decanoato (*Halopidol decanoato*)
 Bromperidol decanoato (*Bromodol decanoato*)
 Pimozida (*Orap 24*)
 Fluspirileno (*Imap*) I.M.
 Pipotiazina (*Piportyl L4*) I.M.

Indicados en pacientes que se niegan a ser medicados o tienen dificultades para cumplir la medicación

NUEVOS ANTIPSICÓTICOS DENOMINADOS TAMBIEN "ATIPIICOS"

1.ATIPIICOS O CONVENCIONALES:

Clozapina
 Olanzapina

Risperidona (a dosis bajas, < de 6 mg)

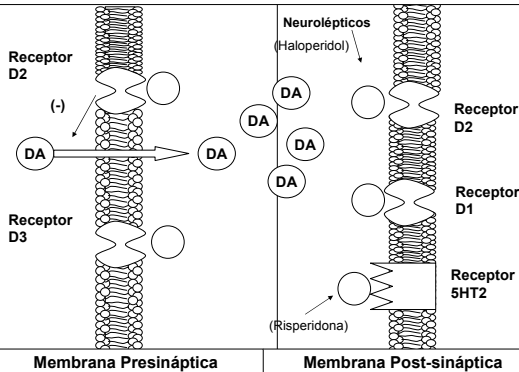
Ziprasidona
 Sulpirida
 Quetiapina.

Menores Efectos Extrapiramidales

-No han superado en eficacia a los más antiguos
 -Poseen un perfil diferente de efectos adversos
 -Su costo es mayor

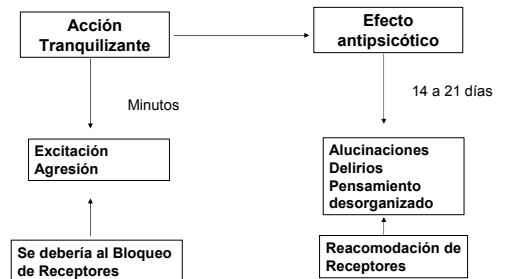
Dra. Lorena Dos Santos- Cátedra de Farmacología

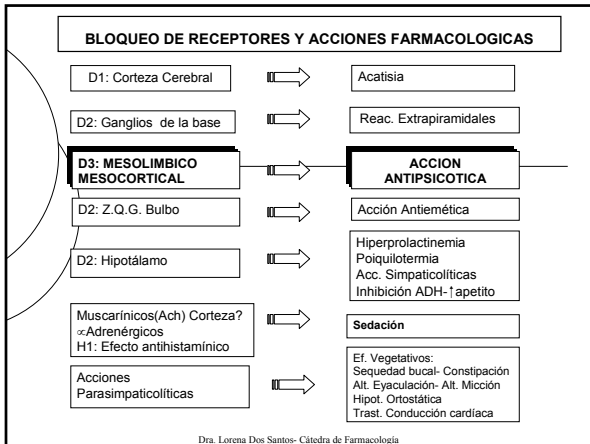
Mecanismo de Acción



Cátedra de Farmacología. Facultad de Medicina

NEUROLEPTICOS





- ATIPIICOS**
- Principales Efectos Adversos
- ♣ Aumento de peso
 - ♣ Hiperglucemia
 - ♣ Somnolencia
 - ♣ Hipotensión
 - ♣ Trastornos hematológicos (clozapina: aplasia medular)
 - ♣ Convulsiones
 - ♣ Trastornos de la conducción A-V (Ziprasidone)
 - ♣ ACV en anciano (olanzapina)

EFFECTOS NEUROLOGICOS ADVERSOS DE LOS NEUROLÉPTICOS

Reacción	Síntomas	Tiempo de riesgo	Mecanismo propuesto	Tratamiento
Distonia aguda	Espasmos de los músculos: cara, cuello, dorso, lengua	1 a 5 días	No se conoce	* ↓ dosis * Anticolinérgico de acción central
Acetasia	Inquietud motora (no es ansiedad ni agitación)	5 a 60 días	No se conoce	* ↓ Dosis * Cambiarlo por otro.
Parkinsonismo	Temblo-rigidez Bradínesia Trast. Marcha, lenguaje, escritura	5 a 30 días (puede ocurrir luego de una dosis)	Antagonismo de la dopamina	* ↓ Dosis * cambiar de droga * Anticolinérgico de acción central
Temblo peribucal (Síndrome del Conejo)	Temblo peribucal (puede ser una forma tardía del parkinsonismo)	Después de meses o años	No se conoce	* Anticolinérgico de acción central

Dra. Lorena Dos Santos- Cátedra de Farmacología

EFFECTOS NEUROLOGICOS ADVERSOS DE LOS NEUROLÉPTICOS

Reacción	Síntomas	Tiempo de riesgo	Mecanismo propuesto	Tratamiento
Síndrome Neuroléptico Maligno	Confusión mental Fiebre- Catatonia Presión Arterial inestable- Mioglobinemia (Complicación grave Puede ser mortal)	Semanas	No se conoce (puede contribuir el antagonismo de la dopamina)	* Suspender el neuroléptico * Dar dantroleno o Bromocriptina * Antiparkinsonianos
Discinesia Tardía	Discinesia bucofacial Coreoatetosis o distonia generalizada (empeora con al suspensión del fármaco)	Después de meses o años de tratamiento	Desconocido Se supone una función excesiva de dopamina	Fundamental prevención Tratamiento insatisfactorio

Dra. Lorena Dos Santos- Cátedra de Farmacología

CORRELACIONES CLÍNICAS Y NEUROPATOLÓGICAS DE LA ESQUIZOFRENIA TIPO I Y II.

TIPOS	I (Positivo)	II (Negativo)
Historia familiar	Sociopatía	Psicosis mayores
Historia demográfica	Mayor n° de internaciones y uso de psicofármacos	Pacientes mayores
Estado premórbido	Labilidad afectiva ira- ansiedad	Empobrecimiento afectivo Retardo motor Déficits cognitivos
Comienzo	Agudo	Crónico tardío
Respuesta a los neurolépticos	BUENA	REGULAR o MALA
Daño cerebral	Dopamina Alta	Dopamina normal o ↓ Daño neuronal irreversible?
TAC, RNM, PET	Normal ?	Alterada

Dra. Lorena Dos Santos- Cátedra de Farmacología

- ESQUIZOFRENIA CLASIFICACION DE CROW**
- TIPO I : SINTOMAS POSITIVOS**
- 1- Alucinaciones severas dominan el cuadro clínico
 - 2- Delirios (persecutorios, hipocondríacos)
 - 3- Alteración del pensamiento abstracto
 - 4- Conductas bizarras y desorganizadas
 - 5- Lenguaje desorganizado
- TIPO II: SINTOMAS NEGATIVOS:**
- 1- Afecto amortiguado
 - 2- Avoliación - apatía
 - 3- Anhedonia- Asocialidad
 - 4- Deterioro de la atención
- Dra. Lorena Dos Santos- Cátedra de Farmacología

CARACTERÍSTICAS

Tipo I: caracterizada por síntomas positivos, ausencia de deterioro intelectual, estructura encefálica normal y **buena respuesta a los neurolépticos**.

⇓
hiperactividad dopaminérgica

Tipo II: caracterizada por síntomas negativos sobresalientes, deterioro intelectual, ventrículos cerebrales agrandados y **mala respuesta a los neurolépticos**.

⇓
atrofia cerebral y otras anomalías encefálicas estructurales.

PRINCIPALES INDICACIONES TERAPEUTICAS

PSIQUIÁTRICAS:

1. Esquizofrenia
2. Trastorno bipolar (maniaco-depresivo)
3. Enfermedades que cursan con síntomas psicóticos (alucinaciones o delirio)
4. Psicosis tóxicas producidas por alucinógenos como LSD, amfetaminas, cocaína y fenciclidina. El agente más utilizado es el haloperidol.
5. Psicosis inducidas por el alcohol (alucinaciones)
No olvidar que ↓ umbral convulsivo (fenotiazinas)
6. Estados maníacos e hipomaniacos: (haloperidol parenteral).
7. Enfermedad de Guilles de Latourette

NO PSIQUIÁTRICAS:

1. Enfermedad de Huntington
2. Vómitos refractarios e hipo incontrolable.
3. Dolor crónico o terminal.
4. Antihistamínicos (prometazina)
4. Anestesia (neuroleptoanestesia)

Dra. Lorena Dos Santos- Cátedra de Farmacología

CONSIDERACIONES CLÍNICAS ÚTILES CON RESPECTO A LOS NEUROLÉPTICOS

- ♣ Dosis elevadas o Administración parenteral al principio de una psicosis aguda no mejora la respuesta
- ♣ No hay pruebas de que la combinación de antipsicóticos ofrezcan ventajas.
- ♣ La afirmación de que los antipsicóticos atípicos son más efectivos es cuestionable, porque las pruebas que apoyan esta propuesta permanecen inconstantes y, esos beneficios son por lo general limitados
- ♣ Los pacientes psicóticos agudos internados requieren dosis más altas que los ambulatorios, sin embargo en tratamientos prolongados ambos responden a dosis similares.

CONSIDERACIONES CLÍNICAS ÚTILES CON RESPECTO A LOS NEUROLÉPTICOS

- ♣ En los pacientes con Síndromes Cerebrales agudos: Utilizar antipsicóticos de alta potencia. Evitar dar los de baja potencia, porque pueden causar sedación, hipotensión, convulsiones.
- ♣ Y los que tienen efectos anticolinérgicos marcados pueden empeorar la agitación y la confusión.
- ♣ No causan adicción, pero sí dependencia física, por lo que deben suspenderse en forma lenta.

BENEFICIOS DE LA TERAPIA CON NEUROLEPTICOS

- ⇒ Reducen el número de enfermos hospitalizados
- ⇒ Mejoran algunos de los síntomas (en especial los positivos)
- ⇒ Facilitan el desarrollo de programas de rehabilitación individual y comunitaria
- ⇒ Permiten al enfermo pensar con más claridad y relacionarse mejor con su medio ambiente

PRINCIPALES LIMITACIONES

- ⇒ Continúa habiendo recaídas a pesar de mantener el tratamiento
- ⇒ Hay síntomas que no responden y aspectos de la conducta que no mejoran.
- ⇒ Provocan reacciones adversas que complican o perturban la vida del enfermo

Dra. Lorena Dos Santos- Cátedra de Farmacología