

“Stimolanti del sistema nervoso centrale”

Disfunzioni mentali

- Comprendono una vasta gamma di anormalità, dalla psicosi ai cambiamenti di umore o di percezione che possono venire classificati come stati eccitati o depressi
- I composti che aumentano un livello di attività fisiologica inizialmente basso sono classificati come

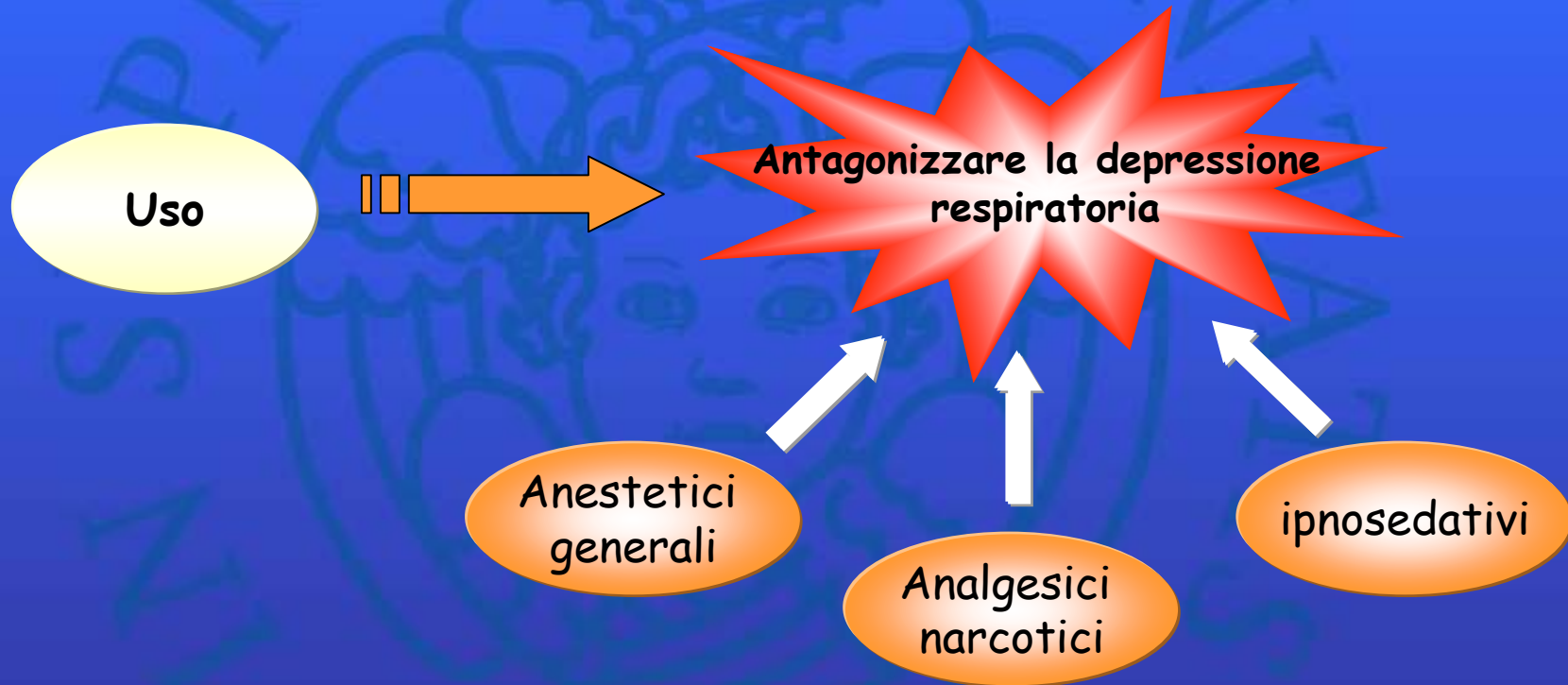
Stimolanti

Stimolanti

- **Stimolanti Respiratori** (da impiegare nel sovradosaggio da depressivi)
 - **Psicostimolanti** (nelle depressioni funzionali o psichiche)
 - **Psicotomimetici o allucinogeni**
-
- Gli **stimolanti psicomotori** producono un'azione generalizzata, spesso seguita da sedazione
 - I **nootropi** producono un'attivazione delle funzioni di adattamento
 - Gli **analettici** producono una stimolazione dei sistemi respiratorio e circolatorio; a dosi elevate possono causare convulsioni

• Analettici

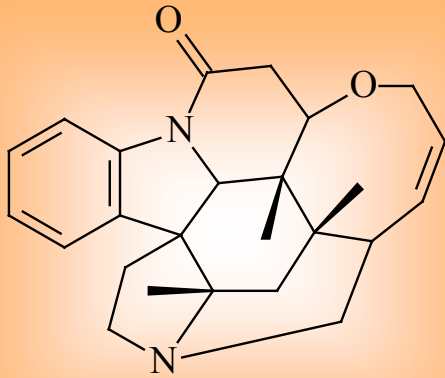
- Stimolano o deprimono la respirazione normale e anormale



• Analettici

- Stimolano o deprimono la respirazione normale e anormale

Meccanismo d'azione



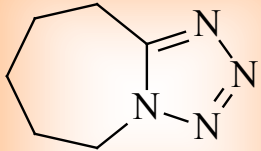
Strychnina

- Inibisce l'azione dei neurotrasmettitori inibitori
- Inibisce il legame della glicina al proprio recettore

- Dopo somministrazione orale viene facilmente assorbito e la sua azione compare entro 45 minuti
- La stricnina è il più debole tra gli analettici
- A piccole dosi non stimola la respirazione
- La dose letale nell'uomo è compresa tra i 60 e 90 mg

• Analettici

- Stimolano o deprimono la respirazione normale e anormale



Pentilentetrazolo

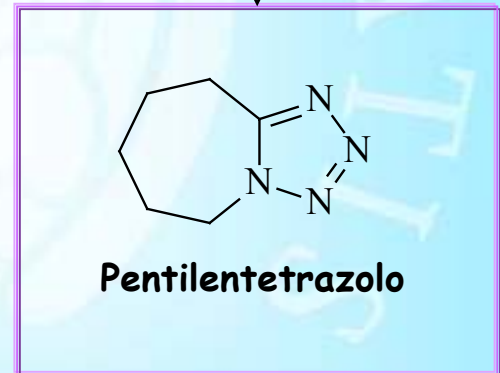
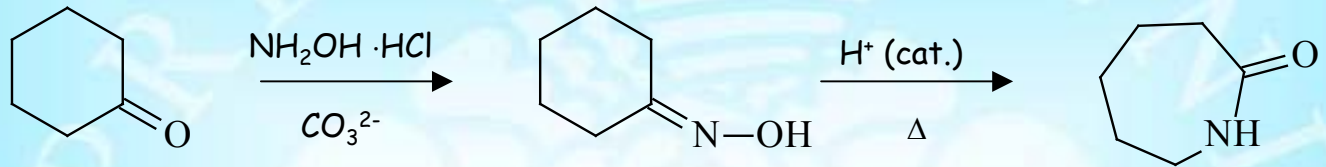
- Impiegato in passato per risolvere, tramite stimolazione centrale (chemioshock) gli stati depressivi

Meccanismo d'azione

- Stimolazione colinergica
- Riduzione delle disponibilità energetiche
- Liberazione di prostaglandine
- Abbassamento della tensione superficiale

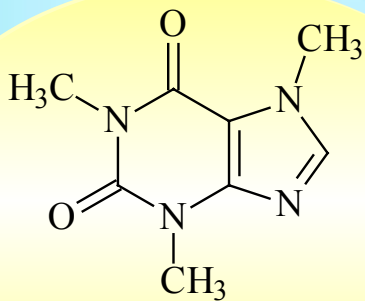
Meccanismi proposti
per la stimolazione
del SNC

Sintesi del pentilentetrazolo



Xantine

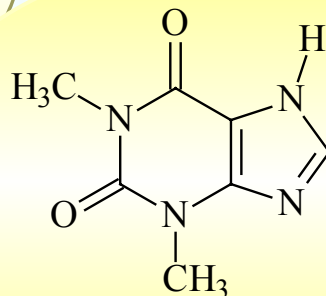
Alcaloide meno
potente



caffaina



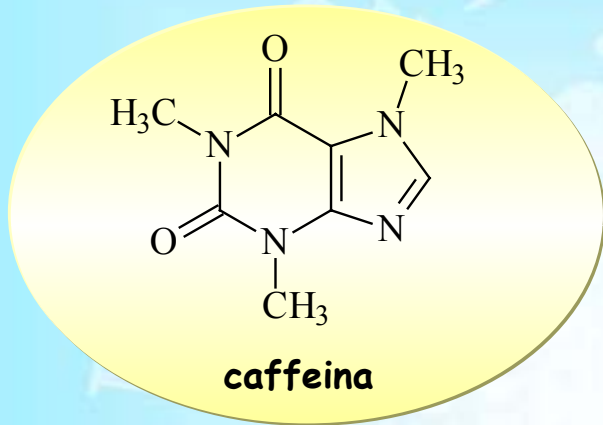
teobromina



teofillina

- E' la più attiva delle xantine
- Stimolante corticale e bulbare.
- A forti dosi è stimolante spinale

Xantine



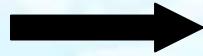
Migliora l'efficienza mentale



Ha un'azione antifatica e antinoia legata alla stimolazione muscolare

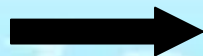
Meccanismo d'azione

• Stimolazione bulbare



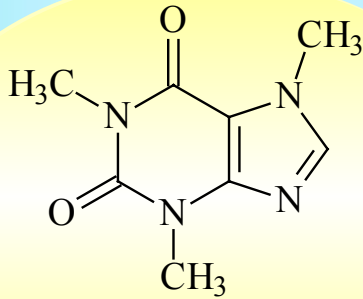
velocità e profondità degli atti respiratori

• Stimolazione centro vasomotore bulbare



Resistenze periferiche

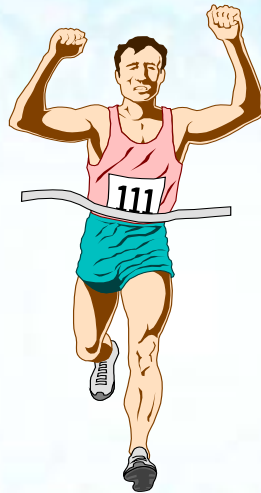
Xantine



caffaina



Migliora l'efficienza mentale

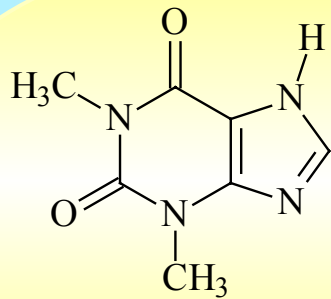


Ha un'azione antifatica e antinoia legata alla stimolazione muscolare

Meccanismo d'azione

- Stimolazione diretta del miocardio (teofillina è più efficace) → ↑ Frequenza e forza contrattile
- riducono le resistenze periferiche → Vasodilatazione diretta a livello coronarico

Xantine



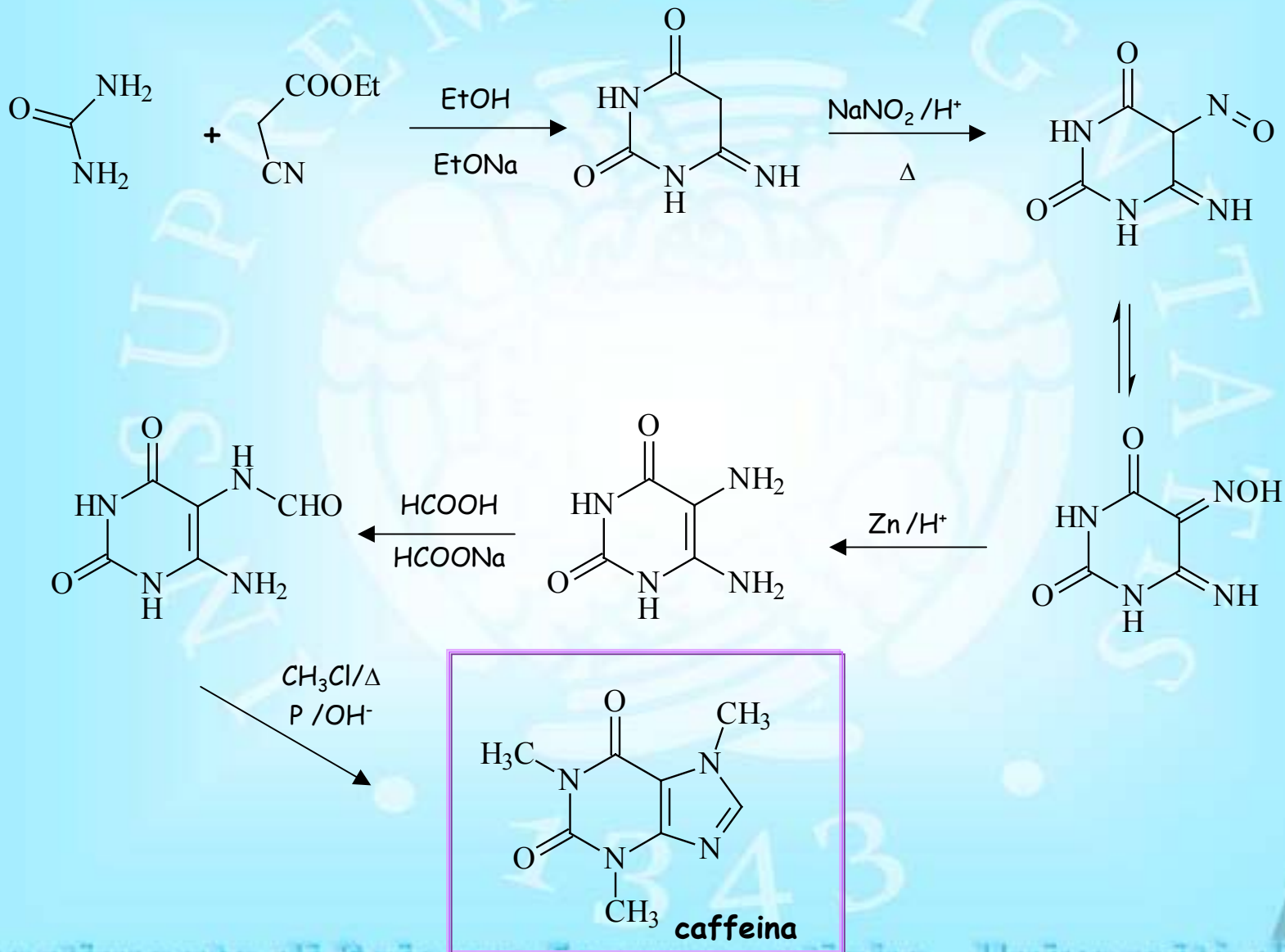
teofillina

- Causa diuresi per aumento della filtrazione glomerulare e per inibizione del riassorbimento di sodio

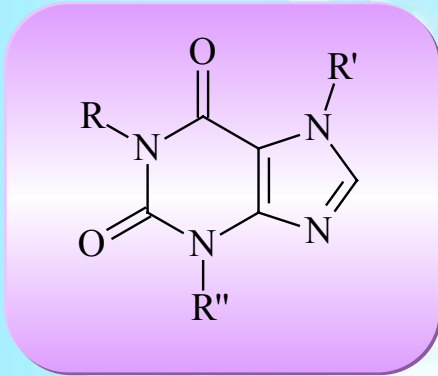
Effetti farmacologici delle xantine

SNC	Euforia, aumento frequenza respiratoria, stimolazione vagale	Muscolatura scheletrica	stimolazione
cuore	aumento frequenza e gittata	reni	diuresi
Muscolatura liscia dei vasi	Vasodilatazione periferica Vasocostrizione centrale		
bronchioli	dilatazione		

Sintesi della caffeina



Azioni farmacologiche delle xantine



➤ Data la stretta correlazione tra xantine e nucleotidi purinici, ne è stata valutata la possibile **MUTAGENICITA'**

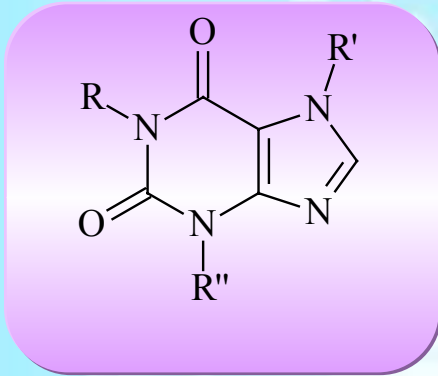
➤ La **caffaina** può essere mutagena per funghi, microorganismi, insetti, ma non rappresenta un rischio significativo di mutagenesi per l'uomo

Meccanismo d'azione

① Le xantine interferiscono nella concentrazione di AMP ciclico (**AMPc =** adenosin-3',5'-monofosfato ciclico)

Nucleotide ciclico che svolge un ruolo biochimico di rilievo in molte reazioni metaboliche e ormonali

Azioni farmacologiche delle xantine



➤ Data la stretta correlazione tra xantine e nucleotidi purinici, ne è stata valutata la possibile **MUTAGENICITA'**

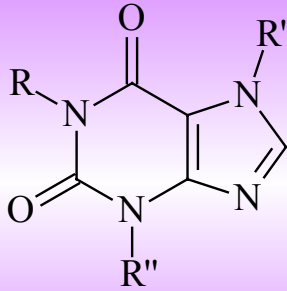
➤ La **caffaina** può essere mutagena per funghi, microorganismi, insetti, ma non rappresenta un rischio significativo di mutagenesi per l'uomo

Meccanismo d'azione

① Le xantine interferiscono nella concentrazione di AMP ciclico (**AMPc** = adenosin-3',5'-monofosfato ciclico)



Azioni farmacologiche delle xantine



➤ Data la stretta correlazione tra xantine e nucleotidi purinici, ne è stata valutata la possibile **MUTAGENICITA'**

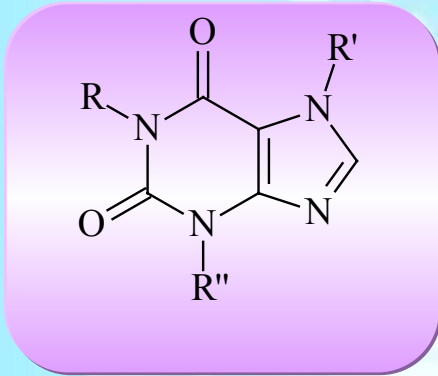
➤ La **caffaina** può essere mutagena per funghi, microorganismi, insetti, ma non rappresenta un rischio significativo di mutagenesi per l'uomo

Meccanismo d'azione

② Le metilxantine sono **inibitori competitivi**, a concentrazioni terapeutiche, di alcuni recettori stimolati dall'**adenosina**.

presente in gran parte delle cellule, esercita notevoli effetti cardiaci, vascolari, metabolici e gastrointestinali

Azioni farmacologiche delle xantine



➤ Data la stretta correlazione tra xantine e nucleotidi purinici, ne è stata valutata la possibile **MUTAGENICITA'**

➤ La **caffeina** può essere mutagena per funghi, microorganismi, insetti, ma non rappresenta un rischio significativo di mutagenesi per l'uomo

Meccanismo d'azione

③ **Caffeina libera ioni calcio** dal reticolo sarcoplasmatico dei muscoli volontari e ne inibisce il riassorbimento



Azioni farmacologiche delle xantine



➤ Data la stretta correlazione tra xantine e nucleotidi purinici, ne è stata valutata la possibile **MUTAGENICITA'**

➤ La **caffaina** può essere mutagena per funghi, microorganismi, insetti, ma non rappresenta un rischio significativo di mutagenesi per l'uomo

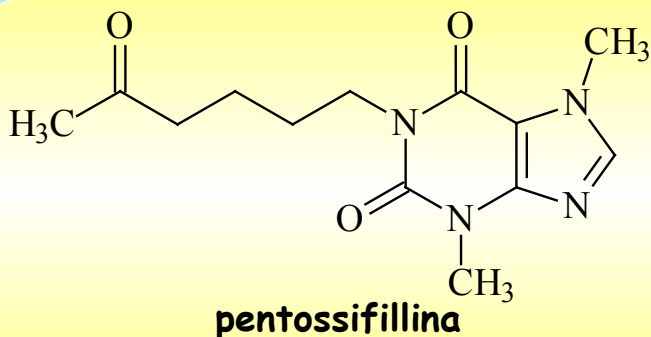
Indicazioni



➤ L'indicazione terapeutica principale è l'**asma**

➤ Impiegate a scopo preventivo nei neonati prematuri per evitare episodi di apnea prolungata

Pentossifillina



➡ Derivato xantinico che incrementa la deformabilità degli eritrociti



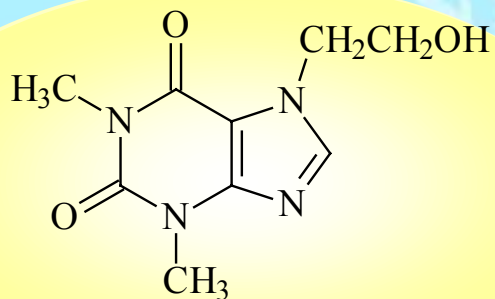
Migliora il flusso del sangue nelle strozzature dovute ad insufficienza arteriosa periferica

Meccanismo d'azione



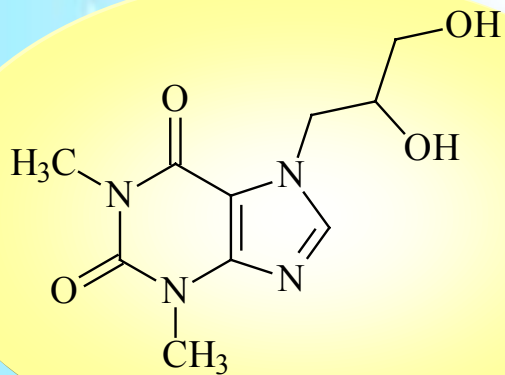
➡ Modifica l'azione di interleukina-1 e del fattore di necrosi cellulare sulla chemiotassi dei neutrofili

Altri analettici...



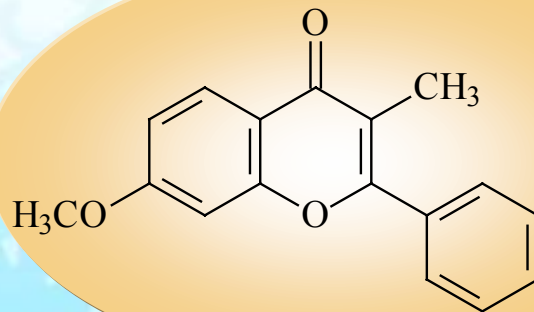
etofyllina

Derivati xantinnici con > solubilità in H₂O



diprofillina

Analettico di tipo flavonico con azione centrale e periferica, attiva soprattutto a livello periferico



Dimeflina