

# butabarbital – butabarbital

Authored by  
**memjavad**

November 11, 2025

## RECOMMENDED CITATION

memjavad (2025). *butabarbital – butabarbital*. Spanish Psychological Databases. Retrieved from <https://spanish.arabpsychology.com/?p=3806>

## Butabarbital

**Primary Disciplinary Field(s):** Farmacología Clínica, Química Médica, Neurofarmacología

### 1. Definición y Clasificación Farmacológica

El butabarbital, conocido químicamente como ácido 5-sec-butil-5-etilbarbitúrico, es un compuesto orgánico que pertenece a la clase de los **barbitúricos**. Esta familia de fármacos se caracteriza por ser derivados del ácido barbitúrico, una estructura cíclica obtenida de la condensación de la urea y el ácido malónico. Históricamente, el butabarbital ha sido clasificado como un depresor del sistema nervioso central (SNC) y se ha empleado primariamente por sus propiedades sedantes e hipnóticas.

Dentro del espectro de acción de los barbitúricos, el butabarbital ocupa una posición intermedia. La clasificación de los barbitúricos depende fundamentalmente de la velocidad de inicio y la duración de sus efectos, que están íntimamente ligados a su liposolubilidad y a la tasa de metabolismo hepático. Mientras que los barbitúricos de acción ultracorta (como el tiopental) se usan en anestesia, y los de acción prolongada (como el fenobarbital) se emplean para el manejo de convulsiones, el butabarbital se utiliza para el tratamiento a corto plazo del insomnio y la ansiedad, ya que su efecto dura significativamente más que el de los agentes de acción corta, pero menos que los de acción prolongada.

A pesar de su eficacia probada como agente hipnótico, el butabarbital ha experimentado un declive significativo en su uso clínico desde finales del siglo XX. Este cambio se debe principalmente a la introducción de la familia de las **benzodiazepinas**, que ofrecen un perfil de seguridad mucho más favorable, especialmente en términos de riesgo de sobredosis letal y menor potencial de dependencia física severa. No obstante, el estudio del butabarbital sigue siendo crucial para comprender la farmacología de los depresores del SNC y la evolución histórica del tratamiento de los trastornos del sueño y la ansiedad.

### 2. Estructura Química y Síntesis

La actividad farmacológica del butabarbital está directamente determinada por su estructura molecular. El núcleo fundamental es el anillo de pirimidina-2,4,6-triona, que constituye el esqueleto del ácido barbitúrico. Las modificaciones químicas cruciales que confieren al butabarbital sus propiedades intermedias residen en la sustitución en el carbono 5 del anillo. En el caso específico del butabarbital, este carbono está unido a dos grupos alquilo: un grupo etilo y un grupo sec-butilo.

La presencia de estos grupos lipofílicos en la posición C5 es esencial, ya que incrementan la solubilidad del compuesto en lípidos. Una mayor liposolubilidad facilita la rápida penetración del fármaco a través de la barrera hematoencefálica, permitiendo un inicio de acción relativamente

rápido tras la administración oral. El balance entre el grupo etilo y el grupo sec-butilo es lo que define su perfil de acción intermedia, diferenciándolo de compuestos con grupos alquilo más grandes (que serían más liposolubles y de acción ultracorta) o más pequeños (que serían menos liposolubles y de acción más prolongada).

La síntesis química del butabarbital, al igual que la de muchos otros barbitúricos, se realiza típicamente mediante una reacción de condensación. Esta reacción involucra la condensación del derivado disustituido del ácido malónico (en este caso, el éster etil(sec-butil)malónico) con urea en presencia de una base fuerte, como el etóxido de sodio. Este proceso forma el anillo de barbitúrico y es fundamental para la producción industrial de la molécula, asegurando la pureza y la configuración estereoquímica requerida para su actividad biológica. La estabilidad de este anillo y la naturaleza de las sustituciones son clave para su metabolismo posterior en el hígado.

### 3. Mecanismo de Acción Neurofarmacológico

El mecanismo de acción primario del butabarbital, compartido con toda la clase de los barbitúricos, se centra en la potenciación de la neurotransmisión inhibitoria en el sistema nervioso central. El principal neurotransmisor inhibitorio en el cerebro de los mamíferos es el ácido gamma-aminobutírico, o **GABA**. El butabarbital ejerce su efecto uniéndose a un sitio alostérico específico en el complejo receptor GABA-A, que es un canal iónico regulado por ligando permeable a los iones cloruro.

Al unirse al receptor GABA-A, el butabarbital no activa directamente el canal de cloruro, sino que aumenta la sensibilidad del receptor a la acción del GABA endógeno. Cuando el GABA se une al receptor en presencia de butabarbital, la conductancia del canal de cloruro se incrementa significativamente. Esto permite una mayor entrada de iones cloruro (Cl<sup>-</sup>) en la neurona postsináptica, lo que resulta en una hiperpolarización de la membrana. Esta hiperpolarización hace que la neurona sea menos excitable y más resistente a los estímulos excitatorios, deprimiendo así la actividad neuronal global.

Una característica crucial y peligrosa del butabarbital y otros barbitúricos, que los distingue de las benzodiazepinas, es la manera en que modulan el receptor GABA-A. Mientras que las benzodiazepinas aumentan la *frecuencia* con la que el canal de cloruro se abre en respuesta al GABA, los barbitúricos, incluyendo el butabarbital, aumentan la **duración** del tiempo que el canal permanece abierto. Además, a dosis muy altas, los barbitúricos pueden abrir directamente el canal de cloruro incluso en ausencia de GABA. Este mecanismo intrínseco de apertura del canal es la razón fundamental por la cual los barbitúricos poseen un índice terapéutico estrecho y un riesgo mucho mayor de causar depresión respiratoria letal por sobredosis, ya que su efecto inhibitorio no está limitado por la concentración de GABA.

## 4. Farmacocinética y Metabolismo

La farmacocinética del butabarbital determina la duración y la intensidad de sus efectos clínicos. Tras la administración oral, el butabarbital se absorbe de manera eficiente y relativamente rápida en el tracto gastrointestinal. Debido a su ya mencionada liposolubilidad intermedia, una vez en el torrente sanguíneo, el fármaco se distribuye rápidamente a través de los tejidos del cuerpo, penetrando con facilidad la barrera hematoencefálica para alcanzar su sitio de acción en el SNC.

La duración de acción del butabarbital (típicamente entre 6 y 8 horas) está intrínsecamente ligada a su metabolismo y eliminación. El metabolismo se produce principalmente en el hígado. El butabarbital es sometido a varias reacciones de biotransformación, incluyendo la oxidación de las cadenas laterales en el carbono 5, lo que resulta en la formación de metabolitos inactivos o menos activos. Este proceso metabólico a menudo involucra las enzimas del sistema **citocromo P450** (CYP), específicamente las isoformas CYP2C y CYP3A.

Un aspecto farmacocinético de gran relevancia clínica es el potencial del butabarbital para inducir las enzimas hepáticas microsomales. La inducción enzimática significa que la presencia crónica del butabarbital puede aumentar la velocidad a la que el hígado metaboliza tanto el propio butabarbital (llevando a la tolerancia farmacocinética) como otros medicamentos administrados concomitantemente. Esta capacidad de inducción hepática es una fuente significativa de interacciones medicamentosas, afectando la eficacia de fármacos como los anticoagulantes orales, los anticonceptivos y ciertos antiepilépticos.

La eliminación de los metabolitos inactivos se realiza primariamente a través de la excreción renal. La vida media de eliminación del butabarbital se sitúa generalmente en el rango intermedio, oscilando aproximadamente entre 34 y 50 horas, lo que puede contribuir a la acumulación del fármaco y sus metabolitos si se administra repetidamente, especialmente en pacientes con función hepática o renal comprometida. Esta vida media relativamente larga es la razón por la que, a pesar de ser clasificado como de acción intermedia, puede persistir en el sistema durante un tiempo considerable.

## 5. Usos Terapéuticos Históricos y Actuales

El butabarbital, comercializado bajo nombres como Butisol, gozó de una popularidad considerable durante las décadas de 1950 y 1960. Sus principales indicaciones terapéuticas eran el tratamiento del **insomnio**, la sedación preoperatoria y el manejo de estados de ansiedad y tensión. Su acción intermedia lo hacía ideal para inducir el sueño de manera efectiva, sin la persistencia excesiva de somnolencia al día siguiente (efecto conocido como "resaca") que a menudo se asociaba con los barbitúricos de acción prolongada como el fenobarbital.

En el contexto de la sedación preanestésica, el butabarbital se utilizaba para calmar al paciente

antes de la cirugía, reduciendo la ansiedad y facilitando la inducción de la anestesia general. En el tratamiento de la ansiedad, se prescribía para el manejo a corto plazo de la neurosis y los estados de agitación. Sin embargo, su uso para la ansiedad crónica fue desaconsejado debido al rápido desarrollo de tolerancia y el alto riesgo de dependencia, una limitación que afectó a toda la clase de barbitúricos.

La llegada de las benzodiazepinas (como el diazepam y el clordiazepóxido) marcó el declive de la utilización del butabarbital. Las benzodiazepinas ofrecían un perfil de seguridad significativamente mejorado, ya que su mecanismo de acción no permite la apertura directa del canal de cloruro, haciendo que la depresión respiratoria por sobredosis sea mucho menos probable. Hoy en día, el butabarbital se considera un fármaco de segunda o tercera línea. Su uso se restringe a situaciones muy específicas, como el manejo a corto plazo del insomnio grave donde las benzodiazepinas y los hipnóticos no benzodiazepínicos (fármacos Z) han fallado, o en entornos hospitalarios controlados para la sedación aguda.

## 6. Efectos Adversos, Tolerancia y Riesgo de Dependencia

Los efectos adversos del butabarbital son una de las principales razones de su retirada del uso clínico generalizado. Los efectos secundarios comunes incluyen somnolencia diurna, mareos, ataxia (falta de coordinación muscular), confusión y disfunción cognitiva. Estos efectos son más pronunciados en pacientes de edad avanzada, en quienes el metabolismo es más lento y el riesgo de caídas y delirio es mayor.

El riesgo más grave y potencialmente letal asociado al butabarbital es la **depresión respiratoria**, especialmente en casos de sobredosis intencional o accidental. Debido a su capacidad para deprimir directamente el centro respiratorio en el tronco encefálico, la ingestión de dosis supraterapéuticas puede llevar rápidamente a hipoventilación, coma y muerte. Este estrecho margen de seguridad es una desventaja crítica frente a los hipnóticos modernos.

Además, el butabarbital presenta un alto potencial de desarrollo de tolerancia y dependencia física. La tolerancia se desarrolla rápidamente, obligando al paciente a aumentar la dosis para lograr el mismo efecto terapéutico. La dependencia física se manifiesta cuando la interrupción abrupta del fármaco desencadena un síndrome de abstinencia severo. Los síntomas de abstinencia de butabarbital son graves e incluyen ansiedad extrema, temblores, náuseas, vómitos, y, lo más peligroso, convulsiones tónico-clónicas que pueden ser fatales si no se tratan. Por esta razón, la retirada del butabarbital debe realizarse siempre de forma gradual y bajo supervisión médica estricta.

## 7. Regulación y Estatus Legal

Debido a su potencial de abuso y el riesgo inherente de dependencia física y sobredosis, el

butabarbital está sujeto a un estricto control legal a nivel internacional y nacional. A nivel internacional, los barbitúricos, incluido el butabarbital, están regulados por la Convención de las Naciones Unidas sobre Sustancias Psicotrópicas de 1971, que exige a los países miembros controlar su fabricación, distribución y prescripción.

En Estados Unidos, el butabarbital está clasificado como una Sustancia Controlada de la Lista III (Schedule III) bajo la Ley de Sustancias Controladas ([Controlled Substances Act - CSA](#)) de la Drug Enforcement Administration (DEA). Esta clasificación se aplica a fármacos con un potencial moderado a bajo de dependencia física o alto potencial de dependencia psicológica. La clasificación en la Lista III indica que, aunque el butabarbital tiene un uso médico aceptado, su potencial de abuso es menor que el de las sustancias de las Listas I y II, pero mayor que el de las Listas IV y V.

El estatus legal impone restricciones rigurosas sobre la prescripción y dispensación. La mayoría de las jurisdicciones limitan el número de dosis que pueden prescribirse y requieren procedimientos especiales de seguimiento y documentación. Este control legal refleja el reconocimiento de la comunidad médica y regulatoria sobre la necesidad de equilibrar el valor terapéutico del butabarbital para casos refractarios con el imperativo de mitigar los riesgos de desvío, abuso y las graves consecuencias para la salud pública asociadas a esta clase de medicamentos.

## Lecturas Adicionales

[Barbitúrico - Wikipedia, la enciclopedia libre](#)

[Butabarbital - PubChem, National Institutes of Health \(NIH\)](#)

[U.S. Food and Drug Administration \(FDA\) Resources on Controlled Substances](#)