

Universidad del Sureste,
Campus Pichucalco, Chiapas



Farmacología

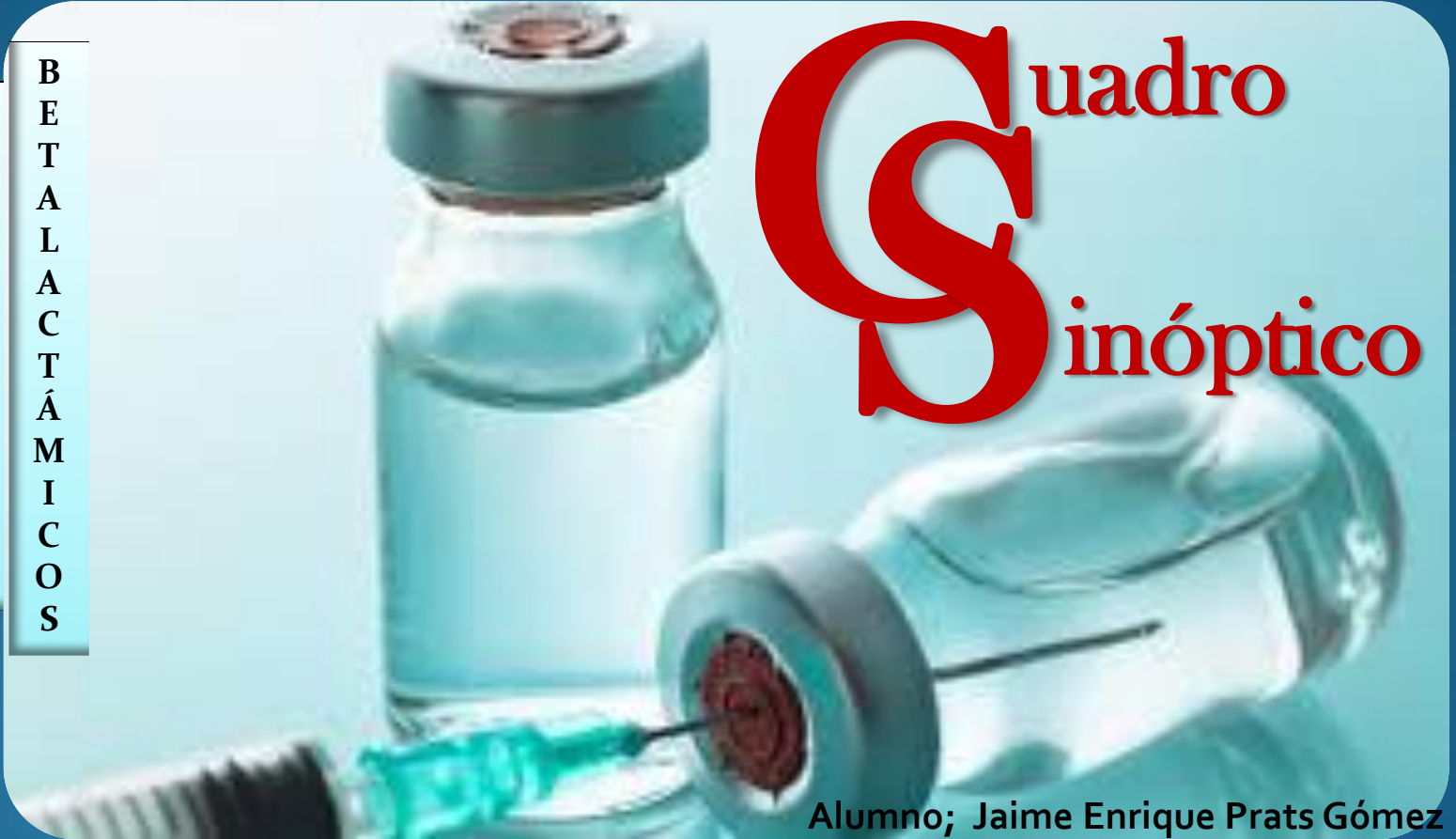
Asesor Académico

Dra. Claudia Guadalupe Figueroa López

A
N
T
I
B
I
Ó
T
I
C
O
S

B
E
T
A
L
A
C
T
Á
M
I
C
O
S

Guadro Sinóptico



Alumno; Jaime Enrique Prats Gómez

Jimmyprats25@gmail.com

MODALIDAD SEMI-ESCOLARIZADO

Carrera: Licenciatura en Enfermería

3er.
Cuatrimestre

Conceptos

ANTIBIOTICOS;

Los antibióticos se utilizan para **tratar las infecciones causadas por bacterias, unos microorganismos unicelulares que pueden provocar enfermedades en los seres vivos.**

Los antibióticos son medicamentos con una gran importancia, hoy en día los percibimos como algo normal, pero tienen **un papel fundamental para preservar la salud.** Todos hemos necesitado antibióticos en algún momento, ¿entendemos su importancia?

Este tipo de fármacos actúan impidiendo que las bacterias se reproduzcan o bien destruyéndolas. No todos los antibióticos son iguales, existen antibióticos de distintas clases, diseñados para combatir diferentes tipos de bacterias.

Lo que no mucha gente sabe, es que **los antibióticos tratan las enfermedades de tipo bacteriano, las virales, pues estas últimas están causadas por virus, unos microorganismos distintos a las bacterias.**

BETALACTAMICOS;

Los **antibióticos betalactámicos** son una amplia clase de antibióticos incluyendo derivados de la penicilina, cefalosporinas, monobactámicos, carbacefem, carbapenems e inhibidores de la betalactamasa; básicamente cualquier agente antibiótico que contenga un anillo B-bactámico en su estructura molecular. Son el grupo más ampliamente usado entre los antibióticos disponibles.

**Antibióticos Betalactámicos y
otros agentes activos en la
Pared Celular y la Membrana**

Compuestos Betalactámicos

Cefalosporinas y Cefamicinas

Otros Medicamentos Betalactámicos

Antibióticos Glucopéptidos

Otros Agentes Activos en la Membrana a la
Pared Celular

**C
o
m
p
u
e
s
t
o
s

B
e
y
a
l
a
c
t
á
m
i
c
o
s**

**P
e
n
i
c
i
l
i
n
a**

Estructura Química

Grupo A - B - R
Amilasas y Lactasas, Penicilina, Cefalosporina, Monobactam, Carbapenem,
Penicilina G, Penicilina V, Oxacilina, Dicloxacilina, Nafcilina, Ampicilina,
Amoxicilina, Piperacilina.

Clasificación

Penicilina G

Grampositivas,
Cocos gramnegativos,
Anaerobios.

Penicilinas
Antiestafilocócicas
(Nafcilina)

Resistentes a las betalactamasas
estafilocónicas.

Activos Estafilococos ,
Streptococos.

Negativos; Enterococos, Bacterias
anaerobias, cocos bacilos
gramnegativos.

Penicilinas de
amplios aspectos

Aminopenicilinas - Antipseudomonas
Aspecto - antibacteriano,
Actividad - Bacilos gramnegativos,
Susceptibles - Hidrolisis.

Unidades y
Formulaciones

Penicilina G

Sodica Cristalina
Semisintéticas

Concentración
Inhibitoria Mínima

Sal de Sodio,
Potasio de Ácido Libre

C
o
m
p
u
e
s
t
o
s

B
e
y
a
l
a
c
t
á
m
i
c
o
s

P
e
n
i
c
i
l
i
n
a

Mecanismos de Acción

Crecimiento bacteriano al interferir con la coacción de transpeptidación, Pared celular con capa externa rígida que rodea la membrana citoplasmática (polisacáridos péptidos), Polisacáridos - amino azucres alternantes, Péptidos - S aminoácidos. Proteína - Elimina la alamina, Enlaces cruzados - rigidez, Mecanismo Exacto - Autolisimas están implicados en alteraciones de enlaces cerrados.-

Resistencia

- Inactivación de Antibióticos,
- Modificación de PEP blanco,
- Penetración alterada del fármaco a PEP blanco,
- Flujo de salida de antibióticos.

Farmacocinética

Absorción

Administración oral
Gastrointestinal erradica
Dosis 1-2 hrs después de una comida

Absorción Intravenosa

Intramuscular
30 mns. Después inyección intravenosa
En 3 semanas los niveles separan la mayoría de las infecciones

Concentración

Son iguales a los sueros,
Excretan en el esputo y leche materna,
Excreta de manera rápida en los niños.

C
o
m
p
u
e
s
t
o
s

B
e
y
a
l
a
c
t
á
m
i
c
o
s

P
e
n
i
c
i
l
i
n
a

Usos Clínicos

Vía Oral,
Administración 1-2 hrs antes o después de cada comida,
No se deben de administrar con alimentos,
Amoxicilina = Administración es individual a las comidas,
Nivel sanguíneo = aumenta con provenid,
No deben usarse para infecciones virales,
Prescribirse a una infección documentada.

Penicilina G { Fármaco de elección para las infecciones causadas por estreptococos - meningococos

Penicilina V { Fármaco oral, indicada en las infecciones menores - 4 veces al día.

Penicilina Benzatinica y Penicilina G Procaica { Inyección intramuscular provocan niveles bajos

Penicilinas Resistentes { Betalactamasa estafilocócica, Meticilina, Nafcilina, Isoxazlil, Estas penicilinas semisinteticas están indicadas para las infecciones causadas por estafilococos productores de betalactamasa.

Penicilina de amplio espectro { Aminopenicilina, Carboxipenicilina, Urcidopenicilina, Estos fármacos tienen una actividad mayor de penicilina frente a las bacterias gramnegativas, debido a su capacidad mejorada para penetrar en la membrana.

C
o
m
p
u
e
s
t
o
s

B
e
y
a
l
a
c
t
á
m
i
c
o
s

P
e
n
i
c
i
l
i
n
a

Reacciones
Adversas

- ❖ Por lo general son bien toleradas y desafortunadamente puede alentar su uso inadecuado;
- ❖ Hipersensibilidad,
- ❖ Determinantes Antigénicas,
- ❖ Historial 5-8 % en personas,
- ❖ Reacción grave de 1%, reacción alérgicas,
- ❖ Medicamentos sustitutos,
- ❖ Reacciones alérgicas incluyen choques anafilácticos,
- ❖ En pacientes con insuficiencia renal = dosis altas causan convulsiones,
- ❖ Dosis grandes vía oral = provocan malestar gastrointestinales,
- ❖ Asociada colitis PSEUDOMEMBRANOSOS.

Similares a la PENICILINA pero más estables cepas E (Cali y klebsiella sp), son de preocupación clínica.

C
e
f
a
l
o
s
p
o
r
i
n
a
s

y

C
e
f
a
m
i
c
i
n
a
s

Estructura Química

Aminocefalosporánico,
Aminopenicilánico,
Unión de grupos R - Ra

Clasificación

- Cefazolina – Cefalexina - Cefadroxilo,
- Cefoxitina – Cefaclor – Cefproxil – Cefuroxina – Cefotetan,
- Cefotaxina – Cefpodoxima – Ceftibutén – Cefdimir - Ceftriaxona – Ceftazidima ,
- Cefepima,
- Ceftarolina – Certolozano R1.

Características de
Primera Generación

Cefazolina – Cefadroxilo UNICAS EN ESTADOS UNIDOS – Cefalexina – Cefalonia – Cefapirina -
Cefradina

Farmacocinética y Dosificación

Oral

Agentes de 1ª generación EEUU,
Después de la dosis 500g los niveles séricos máximos 15-20 mc/ml,
Concentración URINARIA muy alta,
Pacientes con problemas urinarios,
Pacientes con insuficiencia renal.

Parental

Cefazolina es el único parental que se usa general,
Dosis intravenosa cada 8 hrs,
Dosis intramuscular.

Usos
Clínicos

Orales se usan en tratamiento de infecciones del tracto urinario – infecciones por estafilococos o estreptococos,
La Cefazolina es un fármaco de elección para la profilaxis quirúrgica,
La Cefazolina penetra en la mayoría de los tejidos,
La Cefazolina no penetra en el Sistema Nervioso Central,
No se usa en la Meningitis,
Uso en pacientes con alergias leves a la penicilina que no sea hipersensibilidad inmediata.

C
e
f
a
l
o
s
p
o
r
i
n
a
s

y

C
e
f
a
m
i
c
i
n
a
s

Cefalosporinas de Segunda Generación

Cefaclor – Cefprozil – Cefuroxima disponibles en Estados Unidos – Cefamandol – Cefonicida – Loracarbet – Ceforanida estas tienen actividad anaeróbica, Grupo heterogéneo, diferencia individual, actividad farmacocinética y toxicidad, Activos con organismos, No deben usarse en infecciones por Enterbacter

Oral

Dosis en adultos 250mg – 500mg 2 veces al día
Niños 20-40 mg/kg / día

Parental

Infusión intravenosa 1g,
Niveles séricos 75-125 mg /ml,
Intramuscular es dolorosa = EVITAR

Uso Clínico

Son activos con productoras de lactamasas,
Tratan la SINUSITIS – OTITIS – Infecciones del Tracto Respiratorio Inferior, NEUMONIA.

Cefalosporinas de Tercera Generación

Cefoperazona – Ceftizoxima – Moxalactama ya no son convencionales en Estado Unidos – Cefotaxima – Ceftazidima – Cefpodoxima – Próstilo – Cefdimir – Cefditoren pivoxilo – Ceftibuten.

Actividad antimicrobiana

Expansión gramnegativas,
Activos citrobacter – S. marcescens y Providencia,
Efectivos productoras Haemophilus y Neisseria,
Activo útil P. aeruginosa.

Farmacocinética y Dosificación

Infusión intravenosa 1g produce niveles séricos 7-8 hrs inyectar 24 hrs 15-50 mg/kg/d,
Infecciones 2g cada 12 hrs Meningitis 2g cada 24 hrs, Resto de la vida 6-8 hrs,
La excreción se produce principalmente en el tracto biliar, Excreta por el riñón.

Uso Clínico

Infecciones graves causadas por otros fármacos,
Evitar Cefalosporinas,
Ceftriaxona – Cefotaxima = Meningitis,
Ceftriaxona – Cefotaxima = no son susceptibles a la Penicilina.

C
e
f
a
l
o
s
p
o
r
i
n
a
s

Y

C
e
f
a
m
i
c
i
n
a
s

Cefalosporinas de Cuarta Generación

- ❖ Cefepima,
- ❖ Resistente a la hidrólisis cromosómicas,
- ❖ Activo con la Aeruginosa,
- ❖ Penetra bien en el fluido cerebroespinal,
- ❖ Eliminada por los riñones – semivida 2 hrs,
- ❖ Dosis 1-2g cada 12 hrs.,
- ❖ Infecciones complicadas,
- ❖ Aumento de dosis 2g cada 8 hrs.

Cefalosporinas activas contra estafilococos resistentes a la penicilina

Actualmente ya están desarrolladas,
Primer fármaco aprobado en Estado Unidos Cefarolina a la penicilina,
No activo Amp C,
Tratamiento de la piel y tejidos blandos y Neumonía adquirida por una dosis 600mg cada 12w hrs.,
De manera no indicada se utiliza en Endocarditis y Osteomielitis – 600mg cada 8 hrs.,
Excreta en la vía Renal,
Ajuste de dosis en Insuficiencia Renal.

Cefalosporinas combinadas con inhibidores de la Betalactamasas

Combatir infecciones gramnegativas,
Ceftolozano – Tazobactam – Ceftazidima – Avibactam – aprobadas para el tratamiento de infecciones intraabdominales,
Infecciones del tracto urinario.

Efectos Adversos de Cefalosporinas

Alergias

- Reacciones de hipersensibilidad Anafilaxis, fiebre, Erupciones Cutáneas, Nefritis, Granulocitopenica, y Anemia Hemolítica.
- Los pacientes con Anafilaxis documentada tienen mayor reacción en comparación de pacientes con alergias,
- La Alerginicidad cruzada es más común entre las penicilinas.

Toxicidad

- Irritación local produce dolor después de la inyección intramuscular y tromboflebitis inyección intravenosa,
- Toxicidad renal incluida la Nefritis intersticial y la necrosis tubular,
- Administración en vitamina oral K 10mg 2 veces a la semana,
- Evitar el Alcohol.

O
t
r
o
s

M
e
d
i
c
a
m
e
n
t
o
s

B
E
T
A
L
A
C
T
A
M
I
C
O
S

Monobactams

- ❖ Fármacos con un anillo mono cíclico,
- ❖ Actividad se limita a organismos aeróbicos,
- ❖ No tienen actividad contra bacterias Gram positivas,
- ❖ AZTREONAM único disponible en EEUU,
- ❖ Administración vía intravenosa cada 8 hrs 1-2 g.,
- ❖ Prolongada en insuficiencia renal 1—2 hrs /100mg,
- ❖ Pacientes alérgicos toleran AZTREONAM,
- ❖ En ocasiones aparecen erupciones cutáneas,
- ❖ Pacientes con antecedentes anafilaxia pueden usarse para tratar infecciones graves como - Neumonía, Meningitis y Sepsis.

Inhibiciones de
Betactamasa

- Acido clavulanico - Sulbactam - Tazobactam - Avibactam,
- Inhibidores tradicionales,
- Acción antibacteriana,
- No todas pueden proteger alas penicilinas,
- La betalactamasa clase C no son buenos inhibidores,
- La combinación de un inhibidor se usan frecuentemente como terapia empirica.

Carbapenems

- ❑ Relacionados con otros antibióticos,
- ❑ Doripenems - Ertapenem - Imipenem - Meropenem tienen licencia en EEUU,
- ❑ Penetran en los tejidos y fluidos corporales,
- ❑ Todos se eliminan vía renal,
- ❑ Indicados para infecciones resistentes a otros fármacos,
- ❑ Activos a muchas cepas,
- ❑ Tratamiento para infecciones gramnegativas,
- ❑ Efectos adversos = Nauseas, Vómito, Diarrea, Erupciones Cutáneas, Sitios de infección.

Antibióticos GLUCOPÉPTIDOS

Vanomicina

- ❖ Antibiótico aislado de las bacterias,
- ❖ Activo a bacterias Gram positivas,
- ❖ Intravenoso soluble en agua,
- ❖ Estable 14 días refrigerado.

Mecanismos de Acción y bases de resistencia

- Inhibe la síntesis de pared celular,
- Inhibe la transglucosilasa,
- Peptidoglucano se debilita y la célula se vuelve susceptible a la lisis,
- La membrana celular se daña y contribuye al efecto antibacteriano,
- La resistencia se debe a la modificación del sitio de unión del bloque constante,
- Pared celular bacteriana G= no acetil glucosamina, M ácido, N= acetilmurámico.

Actividad antibacteriana

- Bacterias para las Gram positivas,
- Resistentes a las Nafcilina y la Meticilina,
- Mata a los Estafilococos,
- Sinérgica con la Gentamicina y la estreptomina
- Activa contra muchos anaeróbicos.

Farmacocinética

- ✓ Se absorbe poco en el tracto intestinal,
- ✓ Administrado por vía oral - tratamiento de Colitis
- ✓ La dosis se administra vía intravenosa,
- ✓ El fármaco se excreta por filtración glomérulos
- ✓ Infusión 1g / 1 hrs produce niveles sanguíneos de 15-30 mg/ml 1-2 hrs.

Usos Clínicos

- Infecciones del torrente sanguíneo, Endocarditis causada por Meticilina,
- Combinada con Gentamicina alternativa para el tratamiento Endocarditis,
- En combinación Cefotaxima - Ceftriaxona - Rifampicina se recomienda para el tratamiento de la Meningitis.

Reacciones adversas

- ⚡ Son menores y reversibles,
- ⚡ Irritantes a los tejidos,
- ⚡ Causa fiebre en el sitio de la inyección,
- ⚡ Enrojecimiento infusión causada histamina.

TEICOPLASMA

Antibiótico glucopéptico similar a la vanomicina, su mecanismo de acción y aspecto antibacteriano puede administrarse vía intramuscular - intravenosa - semivida 45-70 hrs dosificación de 1 día.

O
t
r
o
s
A
g
e
n
t
e
s
A
c
t
i
v
o
s
E
n
L
a
M
e
m
b
r
a
n
a
P
a
r
e
d
C
é
l
u
l
a
r

Daptomicina

- ❖ Nuevo producto de fermentación lipopéptido cíclico,
- ❖ Actividad rápida que la vancomicina,
- ❖ Mecanismo preciso pero una ala membrana,
- ❖ Se elimina vía Renal,
- ❖ Dosis 4mg/kg piel y tejidos blandos,
- ❖ Causa Neumonitis alérgica que reciben terapias,
- ❖ Alternativa a la Vancomicina.

Fosfomicina

- Sal estable fosfomicina,
- Estructuralmente no está relacionado con ningún otro agente antimicrobiano,
- Inhibe enzimas citoplásmicas,
- El fármaco se transporta mediante glicerofosfato,
- La resistencia se transporta del medicamento a la célula,
- Formulaciones Oral y Parental,
- Excreta por los riñones . Concentración Urinaria,
- Dosis 3g infecciones urinarias, 3g cada 3 días - 9 días Prostatitis.

Bacitracina

- ✓ Mezcla de péptidos cíclicos,
- ✓ Activa contra microorganismos Gram positivos,
- ✓ Neurotóxica se usa de manera tópica,
- ✓ Base de pomada combinada con polimixina,
- ✓ Tratamiento en infecciones a la Flora Bacteriana mixta en la superficie de la Piel - Membranas Mucosas,
- ✓ No se debe de aplicar en heridas con el fin de prevenir las infecciones.

Cicloserina

- ⚡ Antibiótico soluble en agua,
- ⚡ Inestable en el PH ácido,
- ⚡ Inhibe en organismos Gram positivos - gramnegativos,
- ⚡ Tratar tuberculosis,
- ⚡ Después de la ingestión los niveles sanguíneos alcanzan 20-30 mg/ml,
- ⚡ Se distribuye ampliamente en los tejidos,
- ⚡ Se excreta en la orina,
- ⚡ Dosis 0.5 - 1g por día entre 2-3 dosis,
- ⚡ Causa toxicidad grave con la dosis del Sistema Nervio Central Cefaleas - Temblores, Psicosis Aguda y Convulsiones,
- ⚡ Si la dosis se mantiene por debajo de 0.75 g/d se puede evitar los efectos.