Universidad del sureste

Dr. Alfredo lopez lopez

Terapia farmacológica

TETRACICLINAS Y SULFAMIDAS

Hannia del Carmen Salazar Jimenez

**Tetraclicinas**

Acción

 La tetraciclina clorhidrato es un antibiótico con acción bacteriostática, y actúa inhibiendo la síntesis protéica. Posee un amplio espectro frente a gérmenes Gram-positivos y Gram-negativos, habiéndose comprobado su actividad "in vitro" entre otros frente a los microorganismos siguientes:

a) Rickettsias, Mycoplasma pneumoniae, Chlamydia sp, Vibrio Cholerae, Bacteroides sp, Brucella sp.

b) Escherichia coli, Enterobacter aerogenes, Shigella sp. Haemophilus influenzae, Klebsiella sp, Streptococcus sp, Diplococcus pneumoniae, Saphylococcus aureus.

c) Neisseria gonorrhoeae, Treponema Pallidum, Listeria monocytogenes, Clostridium sp, Bacillus anthracis, Actinomyces sp.

Indicaciones

 Tratamiento de infecciones causadas por cepas sensibles de los microorganismos anteriormente citados tales como:

 Infecciones otorrinolaringológicas y dentales

 Infecciones respiratorias

Uretritis (no gonocócica)

Infecciones gastrointestinales

* Infecciones genitourinarias
* Infecciones de la piel y tejidos blandos
* Brucelosis (asociada con estreptomicina)
* Tifus exantemático, psitacossis.

Posología

Debe administrarse una hora antes o dos horas después de las comidas, ya que la presencia de alimentos retarda su absorción. No debe ingerirse simultáneamente con leche o derivados lácteos, puesto que los iones calcio disminuyen la absorción de la tetraciclina.

 Adultos: En infecciones leves, 250 mg cada 6 horas ó 500 mg cada 12 horas. En infecciones severas 500 mg cada 6 horas. La tetraciclina aparece en las pautas de erradicación de Helicobacter pilory.

 Niños: 25 a 50 mg/kg de peso y día cada 6 horas (No se utilizará en niños de edad inferior a ocho años). El tratamiento debe continuar durante 24 a 48 horas después de que los síntomas hayan desaparecido. En casos de insuficiencia hepática o renal, la posología debe adaptarse al grado de insuficiencia.

Contraindicaciones

Está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad a las tetraciclinas.

 No se utilizará en embarazadas (durante la segunda mitad de la gestación) ni durante la lactancia. No se utilizará en niños de edad inferior a ocho años, a menos que otro tipo de antibióticos no puedan ser administrados y la gravedad del cuadro lo justifique.

Porfiria. Efectos adversos

El uso de la tetraciclina durante el desarrollo dental (segunda mitad del embarazo, lactancia y niños menores de ocho años), puede causar coloración permanente en los dientes.

 La fijación de tetraciclina en los huesos de los niños causa inhibición del desarrollo óseo, que cesa al suspender el tratamiento.

Alteraciones gastrointestinales: anorexia, náuseas, vómitos y diarrea.

Debido a una acción antianabólica de las tetraciclinas sobre las proteínas, puede producirse a veces un aumento de la urea sanguínea.

 Reacciones de hipersensibilidad: urticaria, erupciones, dermatitis.

 En algunas ocasiones pueden presentarse reacciones de fotosensibilidad después de una exposición solar directa durante el tratamiento.

 Pueden aparecer sobreinfecciones producidas por gérmenes resistentes en cuyo caso debe suspenderse el tratamiento y aplicar la terapia adecuada.

 En algunas ocasiones puede producirse anemia hemolítica, trombocitopenia y eosinofilia.

Precauciones

 Debe utilizarse con precaución en pacientes con las funciones hepática alterada y en aquéllos con historial alérgico anterior fundamentalmente medicamentoso.

* En IR moderada o grave puede aparecer procesos de azotemia, hiperfosfatemia y acidosis.
* En terapias prolongadas deben realizarse controles hematológicos y de las funciones renal o hepática. Interacciones
* Antiácidos conteniendo aluminio, hierro, calcio o magnesio.
* No debe asociarse con otros medicamentos potencialmente hepatóxicos o nefrotóxicos, en pacientes con las funciones hepática o renal alteradas, ni debe administrarse conjuntamente con antibióticos bactericidas.
* En tratamiento simultáneo con anticoagulantes, la dosificación de éstos debe ser reducida.

**SULFAMIDAS**

Las sulfas fueron las primeras drogas usadas efectivamente para combatir las infecciones. Debe destacarse la importancia médica del descubrimiento de éstos agentes, que juntamente con los antibióticos significaron uno de los más grandes avances terapéuticos de los tiempos modernos. La morbimortalidad por infecciones disminuyó en forma considerable desde que el uso clínico de las sulfas y antibióticos se generalizó. Debido a la aparición de resis tencia bacteriana y al descubrimiento de fármacos más activos y menos tóxicos, las sulfas fueron dejadas de lado por mucho tiempo. Sin embargo actualmente, con la recuperación de la sensibilidad de algunas bacterias y la aparición de la trimetoprima que se puede combinar con las sulfas y actuar sinérgicamente con ellas, las sulfas han reconquistado algunas indicaciones importantes en quimioterapia antimicrobiana. Se han sintetizado muchos compuestos y solo algunos tienen valor terapéutico. Todas tienen el mismo mecanismo de acción, y sus diferencias son generalmente farmacocinéticas.

QUIMICA:

 Las sulfamidas forman un grupo de compuestos relacionados con el ácido paraam inobenzoico. Los prerrequisitos mínimos para la actividad antimicrobiana están presentes en la sulfanilamida. El grupo amino libre N (4), es esencial para la actividad antibacteriana, las sulfas que tienen sustituciones en este N deben desdoblarse, liberándolo para poder actuar, así sucede con el Prontosil y con las no absorbibles

La acetilación de este grupo produce la pérdida de la actividad antimicrobiana. Las sustituciones en el grupo sulfamilo N (1), o grupo amida, producen compues tos con variadas propiedades físicas, químicas, farmacológicas, y antibacterianas. Las sulfas son polvos blancos, cristalinos, de sabor amargo, más solubles a PH alcalino que en ácido. Las mayorías de las sulfas se pueden preparar como sales de sodio, que son moderadamente solubles, y se usan para administración IV. Algunas sulfas tienen baja solubilidad (Ftalilsulfatiazol) y pueden permanecer mucho tiempo en el intestino.

CLASIFICACION:

 I-DE ABSORCION Y EXCRECION RAPIDA: Acción corta:

se utilizan principalmente para infecciones urinarias

* Sulfacetamida (Albucid) (colirio)
* Sulfisoxasol (Gantrisin)
* Sulfadiazina (Afonisan)
* Sulfametizol (Urobiotic)

II- DE ACCION INTERMEDIA: Su absorción y excreción es más lenta que las de acción corta. Su mayor uso es en la asociación trimetoprima. El sulfametoxazol se asocia con la trimetoprima, por tener ambos una vida media similar. Las tabletas o suspensiones contienen 400 mg. de sulfametoxazol y 80 mg. de trimetoprima (una relación de 5:1). Esta combinación, por su mayor eficacia ha desplazado casi totalmente al resto de las sulfas de uso sistémico. En la actualidad existen otros compuestos de acción intermedia, que se combinan con la trimetoprima o derivados similares como la tetroxoprima.

* Sulfametoxazol + Trimetoprima (Bactrim)
* Sulfametrol + Trimetoprima (Lidaprim)
* Sulfadiazina + Tetroxoprima (Berco)
* Sulfamoxol + Trimetoprima (Dibactil)

 III- DE ABSORCION RAPIDA Y EXCRECION LENTA: Acción prolongada, se reservan para usos especiales y en terapéutica general. Son más tóxicas que las anteriores.

* Sulfadimetoxina (Madribon)
* Sulfametoxipiridazina (Lederkin).
* Sulfametoxidiazina (Bayrena)

IV- NO ABSORBIBLES:

 Se utilizan para quimioterapia intestinal.

* Ftalilsulfatiazol (Ef- tiazol).
* Succinilsulfatiazol (Pectil)

Ambas sulfas se absorben mal en el tracto gastrointestinal, están conjugadas en N (4), y son por lo tanto inactivas hasta que son hidrolizadas por las bacterias intestinales.

 V- DE USOS ESPECIALES:

* Mafenida (Sulfamilon )
* Sulfadiazina argéntica (Silva dene)
* Salicilazo-sulfapiridina (Azulfidine).

Se usa para colitis ulcerosa, generalmente. \* Se absorben por piel, se usan en quemados.

MECANISMO DE ACCION Las sulfas son análogos estructurales del ácido para-aminobenzoico (PABA). La acción de las sulfonamidas es bacteriostática y es reversible en presencia de exceso de PABA, esto es un buen ejemplo de inhibición competitiva. Las actúan, como dijimos, como antagoni stas competitivos del ácido paraaminobenzoico, debido a que se unen a la enzima tetrahidropteroicosintetasa, que es necesaria para la condensación del PABA y pteridina, que lleva a la formación de ácido fólico o pteroilglutámico, el ácido fólico es convertido en tetrahidrofolato, que actúa como coenzima en la transferencia de gr upos metilos a las bases púricas y pirimídicas para la síntesis del DNA y RNA. De este modo, las sulfonamidas impiden la incorporación de PABA a la molécula de ácido fólico, dificultando su biosíntesis, que es esencial para el crecimiento y multiplicación bacteriana. Los microorganismos sensibles son aquellos que deben sintetizar su propio ácido fólico, o son impermeables al ácido fólico de los líquidos circundantes. Los microorganismos resistentes, son aquellos que son permeables al ácido fólico o al igual que las células del hombre requieren ácido fólico preformado para normal desarrollo. Por su mecanismo de acción, las sulfas son bacteriostáticas, y no bactericidas. La presencia de mecanismos inmunológicos normales, es necesaria para completar la acción de las sulfas.