

RESUMEN DE LOS MEDICAMENTOS

DISEÑO EXPERIMENTAL

ROLANDO DE JESUS PEREZ MENDOZA

DR SAMUEL ESAU FONSECA FIERRO

UDS UNIVERSIDAD DEL SURESTE

RESUMEN DE FARMACOS

SAN CRISTOBAL DE LAS CASAS CHIAPAS

23 DE JUNIO DEL 2021



Penicilinas:

¿Qué son?

Son una subclase de antibióticos llamados antibióticos beta-lactámicos (antibióticos que contienen una estructura química llamada anillo beta-lactámico). Los carbapenémicos, las cefalosporinas y los monobactámicos también son antibióticos betalactámicos.



Farmacocinética:

La penicilina G sódica o potásica se administra por vía intravenosa continua o intermitente o por inyección intramuscular. Las compuestas de procaína y de benzatina se administran por vía intramuscular (IM) solamente. La penicilina G potásica es susceptible a la destrucción por el ácido gástrico, y por lo tanto, cuando se requiere un tratamiento oral, se utilizan la penicilina V o la amoxicilina, que tienen una mayor biodisponibilidad oral. Penetra en la cavidad peritoneal después de la instilación local. Entre el 15-30% de una dosis IM de penicilina G se metaboliza a derivados inactivos. El fármaco se excreta en la orina principalmente a través de la secreción tubular.

Farmacodinamia:

La penicilina G, a pesar de ser de espectro reducido, continúa siendo el medicamento de elección para muchas infecciones causadas por microorganismos sensibles.

Mecanismo de acción:

La penicilina impide la síntesis de la pared de los microorganismos al inhibir la enzima transpeptidasa, acción que evita la formación del peptidoglucano, y por lo tanto el entrecruzamiento de éste que da rigidez y fuerza a la pared de la bacteria.

Dosis:

Adultos y adolescentes: La dosis recomendada es de 20-24 millones de unidades por día IV o IM en 6 dosis divididas durante 10-21 días. Niños: La dosis recomendada es de 250.000-400.000 unidades / kg / día IV o IM en 6 dosis divididas durante 10-21 días.

Efectos adversos:

Los efectos secundarios más frecuentes son dolor de cabeza, picazón vaginal, náuseas o diarrea leves

Cefalosporinas:

¿Qué son?

Las cefalosporinas son antibióticos beta-lactámicos bactericidas

Farmacocinética:

Todas las cefalosporinas tienen una baja penetración en el líquido intracelular y en el humor vítreo. La mayoría de las cefalosporinas se excreta principalmente por la orina, por lo que las dosis deben ajustarse en los pacientes con insuficiencia renal.

Farmacodinamia:

Las cefalosporinas de primera, segunda y tercera generación tienen una farmacodinamia semejante, ya que actúan sobre microorganismos como los cocos y bacilos, que pueden ser de tipo Gram positivos, Gram negativos y espiroquetas.

Mecanismo de acción:

Las cefalosporinas son antibióticos bactericidas y su mecanismo de acción es interferir con la síntesis del componente péptidoglucano de la pared celular bacteriana, a través de la unión a la proteína fijadora de penicilina (PBP) e inactivación de los inhibidores de la autolisina endógena: esta autolisina rompe las paredes celulares bacterianas y produce la muerte del microorganismo por lisis microbiana. Las cefalosporinas, incluyendo las de tercera generación, al fijarse a sus proteínas-blancas en la membrana de la célula bacteriana, inactivan las enzimas implicadas en la síntesis de la pared celular. Por lo general, el germen muere después de la fijación e inactivación de las PBP 1a, 1B5, 2 y 3. (Las PBP 4, 5 y 6 son inactivadas, pero no causan alteraciones letales en el microorganismo).

Dosis:

Cefuroxima (Zinacef-Kefurox) i.m-i.v. 750 mg -1,5 g/d

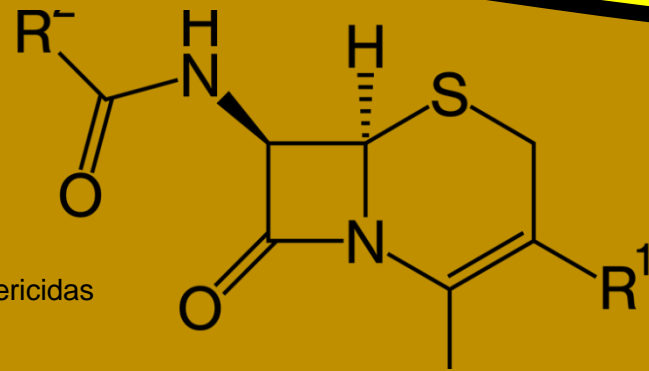
Cefuroxima axetil (Zinnat) Oral 500 mg- 1 g/d

Cefaclor (Ceclor) Oral 250 mg-4 g/d

Cefprozil (Cefzil) Oral de 250-500 mg/ d

Efectos adversos:

Los efectos adversos más frecuentes son el rash dérmico y la fiebre por drogas, que ocurren en un 3 al 10% de casos; también se describen flebitis, prurito y anorexia



Fluoroquinolonas:

¿Qué son?

Las fluoroquinolonas son el grupo de antibióticos formado por ciprofloxacino, levofloxacino, moxifloxacino, norfloxacino y ofloxacino.

Farmacocinética:

La absorción oral disminuye con la administración conjunta de cationes polivalentes (en preparaciones con aluminio, magnesio, calcio, cinc y hierro). Después de la administración oral y parenteral, se distribuyen ampliamente en la mayoría de los líquidos extracelulares e intracelulares, y se concentran en la próstata, los pulmones y la bilis.

La mayoría de las fluoroquinolonas se metabolizan en el hígado y se excretan en la orina, alcanzando altas concentraciones en esta última. La moxifloxacina se elimina principalmente por vía biliar.

Farmacodinamia:

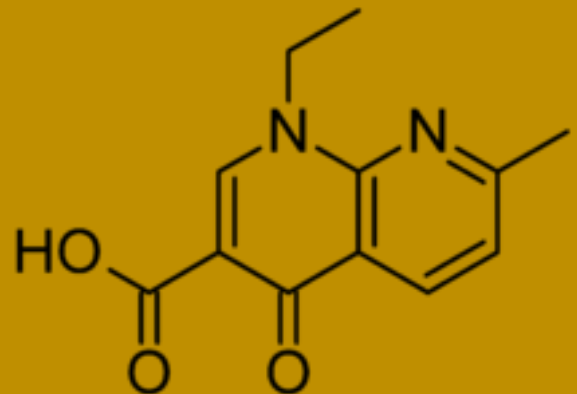
Tienen acción bactericida concentración-dependiente, su actividad bactericida es más pronunciada en tanto la concentración sérica del fármaco aumenta en aproximadamente 30 veces la concentración inhibitoria mínima (CIM).

Mecanismo de acción:

Consiste en la inhibición de la topoisomerasa II, una enzima relacionada con la síntesis y reparación del ADN, se han realizado múltiples estudios para valorar su posible potencial mutagénico y carcinogénico.

Dosis:

Fluoroquinolona	Dosis	ABC
Ciprofloxacino	750 mg	28 a 32 mg/h/L
	500 a 750 mg (oral)	10 a 14 mg/h/L
	500 a 750 mg (oral)	10.1 a 14 mg/h/mL
Levofloxacino	500 mg	48 mg/h/L



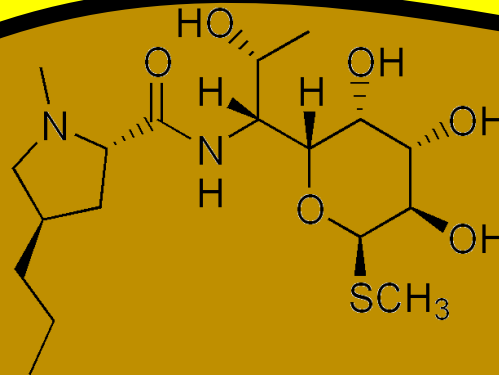
Efectos adversos:

Los efectos secundarios comunes incluyen náusea, diarrea, dolor de cabeza, mareo, vértigo o dificultad para dormir.

Lincosamidas:

¿Qué son?

Las lincosamidas (lincomicina y clindamicina) tienen una actividad microbiológica muy parecida a la de los macrólidos. Los cocos grampositivos y los bacteroides constituyen el blanco de elección de las lincosamidas.



Farmacocinética:

Se absorbe por vía oral de forma rápida y completa; se distribuye ampliamente y alcanza concentraciones elevadas en tejidos de difícil acceso como hueso, próstata, líquidos sinovial, pleural, peritoneal y principalmente en el interior de abscesos y en la bilis. Atraviesa con facilidad la barrera placentaria pero no la hematoencefalica. Se une altamente a proteínas plasmáticas. Su metabolismo es hepático, se transforma en metabolitos activos que se eliminan por la bilis y orina

Farmacodinamia:

Espectro antimicrobiano La actividad es adecuada frente: estafilococos, estreptococos, microorganismos anaerobios grampositivos y gramnegativos y algunos protozoos.

Mecanismo de acción:

Puede tener acción bacteriostática o bactericida, dependiendo de la concentración alcanzada por el fármaco, del sitio de la infección y de la susceptibilidad del organismo infectante. Básicamente inhibe la síntesis de las proteínas de los organismos susceptibles al unirse a la subunidad ribosomal 50 S

Dosis:

Una dosis de 150 y 300 mg, se obtiene el pico en 1 hora

Efectos adversos:

Gastrointestinales: diarrea, náusea, vómito y dolor abdominal. Hematológicas: Leucopenia, leucocitosis, anemia y trombocitopenia Sistema nervioso central: Bloqueo neuromuscular. Piel: Erupciones.

Aminoglucosidos:

¿Qué son?

Los aminoglucósidos son una clase de antibióticos utilizados para tratar infecciones bacterianas graves, como las causadas por bacterias gram-negativas (especialmente *Pseudomonas aeruginosa*).

Farmacocinética:

Estos antibióticos son insuficientemente absorbidos en el torrente sanguíneo cuando se toman por vía oral, por lo que generalmente se inyectan en una vena o, a veces, en un músculo. En Estados Unidos, la kanamicina y la neomicina solo están disponibles para uso tópico y oral (por vía oral se utilizan para descontaminar el tubo digestivo, porque no se absorben). Estos antibióticos se suelen administrar junto con un antibiótico que es eficaz contra muchos tipos de bacterias (denominado antibiótico de amplio espectro).

Farmacodinamia:

Los aminoglucósidos son bactericidas rápidos; su mecanismo de acción es la inhibición de la síntesis proteica por acción directa sobre los ribosomas; alteran la unión del RNAm al ribosoma y modifican la lectura del código genético. Alteran también la membrana citoplasmática y la gradiente electroquímica

Mecanismo de acción:

(AMG) actúan a nivel de la subunidad 30S del ARN ribosomal contribuyendo a la inhibición de la traslocación peptídica. Este mecanismo les suele proporcionar una acción bactericida frente a un gran número de bacilos gramnegativos, que constituyen su principal "target".

Dosis:

GENTAMICINA	1,7 mg/kg/8h	20-30%/24-48h
TOBRAMICINA	1,7 mg/kg/8h	20-30%/24-48h
AMIKACINA	7,5mg/Kg/12h	20-30%/24-48h

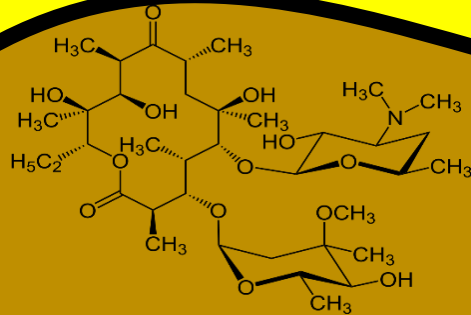
Efectos adversos:

Nefrotoxicidad: elevación reversible de la creatinina y la urea. Es conveniente controlar la dosis del medicamento. ...

Ototoxicidad: alteran neuronas sensitivas de las ramas coclear o vestibular del VIII nervio craneal. Generalmente irreversible porque se produce una muerte neuronal.



Macrolidos:



¿Qué son?

Se usan cuando las penicilinas, cefalosporinas o tetraciclinas están contraindicadas en infecciones por organismos grampositivos y algunos gramnegativos del tracto respiratorio, gastrointestinal, urinarias, de piel y tejidos blandos.

Farmacocinética:

Absorción GI rápida para espiramicina, miocamicina y roxitromicina, la presencia de alimentos disminuye la absorción de azitromicina, eritromicina y roxitromicina, de azitromicina y claritromicina su absorción es de 40 a 50%. Metabolismo hepático, claritromicina se metaboliza a un compuesto de gran actividad contra H. influenzae, de roxitromicina su metabolismo hepático es mínimo, azitromicina no se metaboliza y miocamicina se metaboliza a 4 metabolitos activos. Su vida media ($T_{1/2}$) es variable, de 1 a 8 horas, hasta de 68 horas para azitromicina. Su unión a proteínas es moderada (hasta 70%), hasta de 96% para eritromicina y roxitromicina. Se eliminan por vía renal en un porcentaje bajo (10 a 30%).

Farmacodinamia:

Tienen la particularidad de no pertenecer a una sola categoría. En principio se consideran tiempo-dependientes, es decir que su eficacia clínica depende del intervalo de tiempo durante el cual la concentración en el sitio de acción esté por encima de la concentración inhibitoria mínima calculada para el agente infeccioso.

Mecanismo de acción:

Inhiben la síntesis proteica bacteriana alterando la translocación. Pueden ser bactericidas o bacteriostáticos según la concentración y tipo del microorganismo. La base libre se une a la subunidad 50S del ribosoma bacteriano.

Dosis:

250mg de azitromicina 3 veces por semana si el paciente pesa menos de 40kg o 500mg si el peso es mayor de 40kg, aunque en el estudio realizado sólo en adultos⁷⁶ no se ajusta la dosis según el peso y todos los pacientes reciben la dosis fija de 250mg.

Efectos adversos:

Riesgo de arritmias ventriculares en individuos con prolongación del intervalo QT, alteraciones de función hepática o renal.

Bibliografía:

Brian J. Werth , PharmD, University of Washington School of Pharmacy. (2020). Penicilinas. 24 de junio del 2021, de Manual MSD Sitio web: <https://www.msdmanuals.com/es-mx/hogar/infecciones/antibi%C3%B3ticos/penicilinas>

Brian J. Werth , PharmD, University of Washington School of Pharmacy. (may. 2020). Cefalosporinas. 24 de junio del 2021, de Manual MSD Sitio web: <https://www.msdmanuals.com/es-mx/professional/enfermedades-infecciosas/bacterias-y-f%C3%A1rmacos-antibacterianos/cefalosporinas>

Brian J. Werth , PharmD, University of Washington School of Pharmacy. (may. 2020). Fluoroquinolonas. 24 de junio del 2021, de Manual MSD Sitio web: <https://www.msdmanuals.com/es-mx/professional/enfermedades-infecciosas/bacterias-y-f%C3%A1rmacos-antibacterianos/fluoroquinolonas>

J.-P. StahL. (12/10/09). Lincosamidas . 24 de junio del 2021, de Service des maladies infectieuses et tropicales, centre hospitalier universitaire, B.P. 217, 38043 Grenoble cedex 09, France Sitio web: <https://www.em-consulte.com/es/article/228397/lincosamidas>

Brian J. Werth , PharmD, University of Washington School of Pharmacy. (jul. 2020). Aminoglucósidos. 24 de junio del 2021, de Manual MSD Sitio web: <https://www.msdmanuals.com/es-mx/hogar/infecciones/antibi%C3%B3ticos/aminogluc%C3%B3sidos>

Brian J. Werth , PharmD, University of Washington School of Pharmacy. (jul. 2020). Macrólidos. 24 de junio del 2021, de Manual MSD Sitio web: <https://www.msdmanuals.com/es-mx/hogar/infecciones/antibi%C3%B3ticos/macroc%C3%B3lidos>