

FARMACOLOGIA DE LAS PENICILINAS.

ROLANDO DE JESUS PEREZ MENDOZA

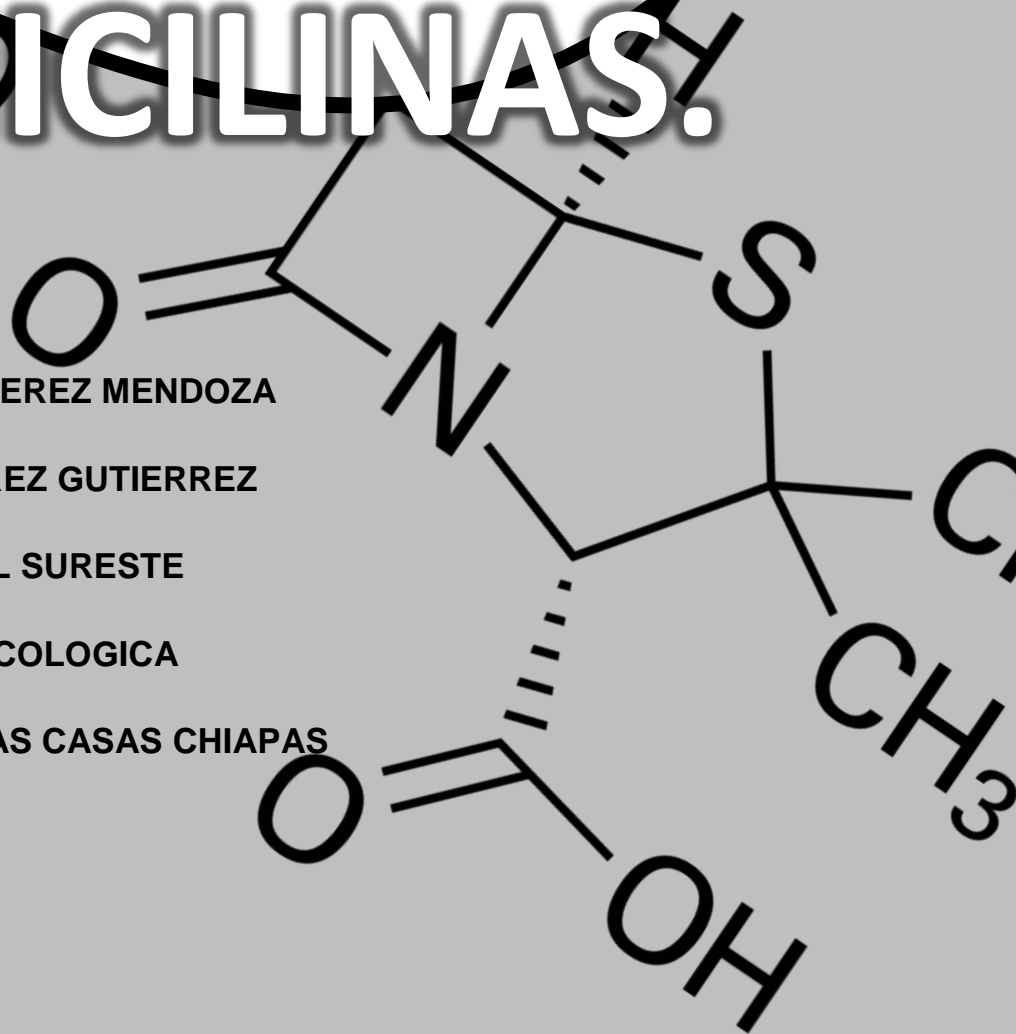
DR LUSVIN IRVIN JUAREZ GUTIERREZ

UDS UNIVERSIDAD DEL SURESTE

TERAPEUTICA FARMACOLOGICA

SAN CRISTOBAL DE LAS CASAS CHIAPAS

06 DE JUNIO DEL 2021



FARMACOLOGIA DE LAS PENICILINAS

Son antibióticos del grupo de los betalactámicos empleados profusamente en el tratamiento de infecciones provocadas por bacterias sensibles

La mayoría de las penicilinas son derivados del ácido 6-aminopenicilánico, difiriendo entre sí según la sustitución en la cadena lateral de su grupo amino.

Mecanismo de acción

Las penicilinas son antibióticos bactericidas, esto es, no simplemente interrumpen la proliferación de las bacterias sino que las destruyen.

Lo hacen interfiriendo con la actividad de las enzimas (por ejemplo transpeptidasa), la cual convierte las moléculas de glucopéptidos de la pared celular en monómeros

Resistencia

El mecanismo de la resistencia bacteriana a las penicilinas cae en tres grandes grupos:

1. Elaboración de sustancias (penicilinasas) que pueden inactivar el antibiótico.

2. Alteración en el sitio receptor. Por medio de enzimas los sitios receptores de la pared celular bacteriana adquieren una configuración diferente no permitiendo la interacción entre receptor y penicilina.

3. Impermeabilidad de la bacteria de modo que el antibiótico no puede alcanzar su objetivo.

La mayor parte de la resistencia alcanzada clínicamente entre las bacterias aeróbicas se atribuye a la formación de enzimas que inactivan el antibiótico. Los genes que controlan la producción de estas enzimas son transportados normalmente en fragmentos extracromosómicos del ácido desoxirribonucleico llamados plásmidos

Farmacocinética

Absorción:

La penicilina V y la amoxicilina exhiben regularmente una absorción por boca mayor del 50%. Sin embargo, otros estudios revelan una absorción del 45% para la penicilina V

La presencia de alimento en el estómago retarda o deteriora la absorción de la mayoría de las penicilinas excepto la penicilina V, ampicilina y amoxicilina

Niveles séricos

Los niveles séricos de varias penicilinas después de una dosis oral de 0,5 g son marcadamente diferentes a causa de los diferentes grados de absorción, metabolismo y grado de unión con las proteínas

Distribución:

Las penicilinas son bastante bien distribuidas en fluido intersticial, cavidades serosas, fluido sinovial, hueso y placenta. Como son relativamente insolubles en lípidos, exhiben poca penetración en las células (incluyendo leucocitos poliformonucleares) y a través de la barrera hematocerebral y las barreras sanguíneas acuosas

Farmacodinamia

La penicilina G, a pesar de ser de espectro reducido, continúa siendo el medicamento de elección para muchas infecciones causadas por mi-cro-organismos sensibles. Al igual que otros antibióticos betalactámicos, la penicilina inhibe la síntesis de pared celular al unirse a las proteínas fijadoras de penicilina.

Con ello, la penicilina inhibe el paso final de transpeptidación en la síntesis de proteoglicano de la pared celular. Es probable que esta acción implique un paso de acilación y la consecuente inhibición de la enzima transpeptidasa, rompiéndose al mismo tiempo el enlace CO-N del anillo betalactámico. Esto ocasiona que la bacteria libere, al mismo tiempo, una serie de enzimas autolíticas (autolisinas y mureína-hidrolasas).

Dosis:

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.

Eliminación:

La principal vía de eliminación de la mayoría de las penicilinas es la vía urinaria, eliminándose a través de ésta la droga como tal; así, la mayor parte de los congéneres producen altas concentraciones urinarias si se absorben.

Efectos secundarios

Las principales reacciones adversas de la penicilina, las reacciones de hipersensibilidad, oscilan en severidad clínica desde la ligera erupción cutánea (con eosinofilia variable) pasando por enfermedad del suero hasta anafilaxia y muerte inmediata.

Bibliografía:

Margarita Castillo. (1980). REVISION SOBRE PENICILINAS. 06 DE JUNIO DEL 2021, de Rev. Cost. Cienc. Méd. Sitio web:
<https://www.binasss.sa.cr/revistas/rccm/v1no1/art1.pdf>

Familia	Antibiótico
PENICILINAS NATURALES	Penicilina G Sódica
	Penicilina G Benzatínica
	Penicilina G Procaína
	Penicilina G Clemizol
	Penicilina V
PENICILINAS SEMISINTÉTICAS	
Aminopenicilinas	Ampicilina Amoxicilina
Penicilinas Isoxazólicas	Oxacilina
	Dicloxacilina
	Flucloxacilina*
	Meticilina*
	Nafcilina*
Carboxi-penicilinas	Carbenicilina* Ticarcilina*
Ureidopenicilinas	Piperacilina
*No se comercializan en el Ecuador	

Algunas veces se ha continuado tratando con penicilinas a pacientes con rash y eosinofilia cuando tal terapia es justificada (endocarditis enterocóccica). Aunque todas las penicilinas son capaces de producir reacciones de hipersensibilidad, las erupciones cutáneas parecen ser más comunes con la ampicilina que con otros congéneres (7 contra 3 por ciento)