



# **Universidad del Sureste**

## **Escuela de Medicina**

**Materia:**

**Farmacología.**

**Mapas.**

**Docente: Dr. Natanael Prado Hernández**

**Alumno: Edwin Dionicio Coutiño Zea**

**3er semestre**

**Grupo: A**

**Lugar y fecha**

**Comitán de Domínguez Chiapas a 11/09/2021.**

# PENICILINA.

Compuesto de betalactama, un anillo de tiazolidina (A) está unido a un anillo de betalactama (B) que porta un grupo amino secundario.

## Clasificación.

**Penicilinas (p. ej., penicilina G):** Éstas tienen una actividad máxima frente a organismos grampositivos, cocos gramnegativos y anaerobios que no producen betalactamasas.

**Penicilinas antiestafilocócicas (p. ej., nafcilina):** Estas penicilinas son resistentes a las betalactamasas estafilocócicas. Son activos contra los estafilococos y los estreptococos, pero no contra los enterococos, las bacterias anaeróbicas y los cocos y bacilos gramnegativos.

**Penicilinas de amplio espectro (aminopenicilinas y penicilinas antipseudomonas):** Estos fármacos retienen el espectro antibacteriano de la penicilina y tienen actividad mejorada contra los bacilos gramnegativos.

## Unidades y formulaciones de penicilina.

La actividad de la penicilina G se definió originalmente en unidades. La penicilina G sódica cristalina contiene aproximadamente 1 600 unidades por mg (1 unidad = 0.6 mcg, 1 millón de unidades de penicilina = 0.6 g). Las penicilinas semisintéticas se recetan por peso en lugar de por unidades.

La concentración inhibitoria mínima (MIC) de cualquier penicilina generalmente se administra en mcg/mL. La mayoría de las penicilinas están formuladas como la sal de sodio o potasio del ácido libre. La penicilina G de potasio contiene aproximadamente 1.7 mEq de K<sup>+</sup> por millón de unidades de penicilina (2.8 mEq/g). La nafcilina contiene Na<sup>+</sup>, 2.8 mEq/g.

## Mecanismo de acción.

Las penicilinas, como todos los antibióticos betalactámicos, inhiben el crecimiento bacteriano al interferir con la reacción de transpeptidación de la síntesis de la pared celular bacteriana.

## Farmacocinética.

La absorción de la mayoría de las penicilinas orales se altera por los alimentos, y los medicamentos deben administrarse al menos 1-2 horas antes o después de una comida. La administración intravenosa de penicilina G es preferible a la vía intramuscular debido a la irritación y el dolor local por la inyección de grandes dosis.

## Usos clínicos.

A excepción de la amoxicilina, las penicilinas orales deben administrarse 1-2 horas antes o después de una comida; no deben administrarse con alimentos para minimizar la unión a las proteínas de los alimentos y la inactivación ácida. La amoxicilina puede administrarse independientemente de las comidas.

## Reacciones adversas.

La mayoría de los efectos adversos graves se deben a la hipersensibilidad. Las reacciones alérgicas incluyen choque anafiláctico, reacciones del tipo de la enfermedad del suero, y una variedad de erupciones en la piel. También pueden ocurrir lesiones orales, fiebre, nefritis intersticial.

Las dosis grandes de penicilinas administradas por vía oral pueden provocar malestar gastrointestinal, especialmente náuseas, vómitos y diarrea.

# CEFALOSPORINAS 1, 2, 3 GENERACION.

## Cefalosporinas de 2da generación.

Éste es un grupo heterogéneo con diferencias individuales en actividad, farmacocinética y toxicidad. En general, las cefalosporinas de segunda generación son relativamente activas contra organismos inhibidos por los fármacos de primera generación, pero, además, tienen una cobertura gramnegativa amplia.

Los miembros de las cefalosporinas de segunda generación incluyen el cefaclor, el cefamandol, la cefonicida, la cefuroxima, el cefprozil, el loracarbef y la ceforanida, de los cuales el cefaclor, la cefuroxima y el cefprozil están disponibles en Estados Unidos y las cefamitinas estructuralmente relacionadas (cefotixina y cefotetán), que tienen actividad contra anaerobios.

### Farmacocinética y dosificación.

**Oral:** La cefuroxima axetil es la cefalosporina oral más comúnmente utilizada en Estados Unidos. La dosis habitual para adultos es de 250- 500 mg por vía oral dos veces al día; los niños deben recibir 20-40 mg/kg/d hasta un máximo de 1 g/d.

**Parenteral:** Después de una infusión intravenosa de 1 g, los niveles séricos son de 75-125 mcg/mL para la mayoría de las cefalosporinas de segunda generación. La administración intramuscular es dolorosa y debe evitarse.

### Usos clínicos.

Las cefalosporinas orales de segunda generación son activas contra *H. influenzae* o *Moraxella catarrhalis* productoras de betalactamasa y se han usado principalmente para tratar la sinusitis, la otitis y las infecciones del tracto respiratorio inferior. La cefotixina y el cefotetán pueden usarse para tratar infecciones anaeróbicas mixtas, como peritonitis, diverticulitis y enfermedad inflamatoria pélvica.

## Cefalosporinas de 1ra generación.

Las cefalosporinas tradicionales no son activas contra las cepas de estafilococos resistentes a la meticilina; sin embargo, se han desarrollado nuevos compuestos que tienen actividad contra cepas resistentes a la meticilina.

### Farmacocinética y dosificación.

**Oral:** La cefalexina es el agente oral de primera generación ampliamente utilizado en Estados Unidos. Después de dosis orales de 500 mg, los niveles séricos máximos son 15-20 mcg/mL. Cefalexina se administra típicamente en dosis orales de 0.25-0.5 g cuatro veces al día (15-30 mg/kg/d).

**Parenteral:** La cefazolina es la única cefalosporina parenteral de primera generación que aún se usa en general. Después de una infusión intravenosa de 1 g, el nivel máximo de cefazolina es de aproximadamente 185 mcg/mL. La dosis intravenosa habitual de cefazolina para adultos es de 0.5-2 g por vía intravenosa cada 8 horas.

### Usos clínicos.

Es un fármaco de elección para la profilaxis quirúrgica y para muchas infecciones estreptocócicas y estafilocócicas que requieren terapia intravenosa. Puede usarse para infecciones causadas por *E. coli* o *K. pneumoniae* cuando se ha documentado que el organismo es susceptible. La cefazolina no penetra el sistema nervioso central y no puede usarse para tratar la meningitis.

## Cefalosporinas 3ra generación.

### Actividad antimicrobiana.

Estos medicamentos han expandido la cobertura gramnegativa, y algunos son capaces de cruzar la barrera hematoencefálica. Los medicamentos de tercera generación pueden ser activos contra *Citrobacter*, *S. marcescens* y *Providencia*. También son efectivos contra las cepas productoras de betalactamasa de *Haemophilus* y *Neisseria*. La ceftazidima es el único agente con actividad útil contra *P. aeruginosa*.

### Farmacocinética y dosificación.

La infusión intravenosa de 1 g de una cefalosporina parenteral produce niveles séricos de 60-140 mcg/mL. Las cefalosporinas de tercera generación penetran bien los fluidos corporales y los tejidos, y las cefalosporinas intravenosas alcanzan niveles en el líquido cefalorraquídeo suficientes para inhibir la mayoría de los patógenos susceptibles.

Las semividas de estos fármacos y los intervalos de dosificación necesarios varían mucho: la ceftriaxona (semivida de 7-8 horas) se puede inyectar una vez cada 24 horas a una dosis de 15-50 mg/kg/d.

### Usos clínicos.

Las cefalosporinas de tercera generación se usan para tratar una amplia variedad de infecciones graves causadas por organismos que son resistentes a la mayoría de los otros fármacos. Las cepas que expresan betalactamasas de espectro extendido, sin embargo, no son susceptibles.

## CARBAPENEMICOS.

### Fármacos.

El doripenem, el ertapenem, el imipenem y el meropenem tienen licencia para su uso en Estados Unidos.

El imipenem, el primer fármaco de esta clase, tiene un amplio espectro con buena actividad contra la mayoría de los bacilos gramnegativos, que incluyen *P. aeruginosa*, organismos grampositivos y anaerobios.

Los carbapenémicos están estructuralmente relacionados con otros antibióticos betalactámicos.

### Mecanismo de acción.

Los carbapenems penetran bien en los tejidos y fluidos corporales, incluido el líquido cefalorraquídeo para todos excepto el ertapenem. Todos se eliminan por vía renal, y la dosis debe reducirse en pacientes con insuficiencia renal.

### Dosis.

La dosis habitual de imipenem es de 0.25-0.5 g por vía intravenosa cada 6-8 horas (semivida de 1 hora). La dosis habitual de meropenem en adultos es de 0.5-1 g por vía intravenosa cada 8 horas. La dosificación adulta habitual de doripenem es 0.5 g administrada como una infusión de 1 o 4 horas cada 8 horas.

### Efectos adversos.

Los efectos adversos más comunes de los carbapenémicos, que tienden a ser más comunes con el imipenem, son náuseas, vómitos, diarrea, erupciones cutáneas y reacciones en los sitios de infusión. Los niveles excesivos de imipenem en pacientes con insuficiencia renal pueden provocar convulsiones.

## MONOBACTAMICOS.

Los monobactams son fármacos con un anillo de betalactama monocíclico. Su espectro de actividad se limita a organismos aeróbicos gramnegativos.

A diferencia de otros antibióticos betalactámicos estos no tienen actividad contra bacterias grampositivas o anaerobios.

### Mecanismo de acción.

Los monobactámicos interfieren en la síntesis de la pared bacteriana, tanto de gramnegativos como de grampositivos, aunque con menos efectos en estos últimos, son bactericidas.

### Inhibidores de betalactamasa.

ácido clavulánico, sulbactam, tazobactam y avibactam.

Los inhibidores de betalactamasa están disponibles sólo en combinaciones fijas con penicilinas y cefalosporinas específicas.

Un inhibidor extiende el espectro de su betalactama acompañante siempre que la inactividad contra un organismo particular se deba a la destrucción por una betalactamasa y que el inhibidor esté activo contra la betalactamasa que se produce.

### Enfermedades en las que se utiliza.

Puede usarse para tratar infecciones graves como neumonía, meningitis y sepsis causadas por patógenos gramnegativos susceptibles.

### Vida media y dosis.

El aztreonam se administra por vía intravenosa cada 8 horas en una dosis de 1-2 g proporcionando niveles séricos máximos de 100 mcg/mL.

La semivida es de 1-2 horas y es muy prolongada en la insuficiencia renal.

### Efectos adversos.

Ocasionalmente aparecen erupciones cutáneas y elevaciones de las aminotransferasas séricas durante la administración de aztreonam, pero la toxicidad mayor es poco común.

### Aztreonam.

Único monobactam disponible en Estados Unidos.

Tiene similitudes estructurales con la ceftazidima, y su espectro gramnegativo es similar al de las cefalosporinas de tercera generación.

Es estable para muchas betalactamasas, con notables excepciones son betalactamasas AmpC y betalactamasas de espectro extendido. Penetra bien en el fluido cerebroespinal.

Referencias bibliográficas.

- Katzung, B. G., & Trevor, A. J. (2016). Farmacología básica y clínica (13a. ed.)