



## MEDICINA HUMANA

**Nombre del alumno: Jhonatan Sanchez Chanona**

**Docente: Natanael Ezri Prado Hernández**

**Nombre del trabajo: "Actividad de Reforzamiento"**

**Materia: Farmacología**

**Grado: 3°**

**Grupo: "B"**

PASIÓN POR EDUCAR

# Penicilinas

## Mecanismo de acción

Inhiben la síntesis de peptidoglucanos de la pared celular

## Clasificación de las penicilinas

### Penicilinas

tienen poca actividad contra los bacilos gramnegativos, y son susceptibles a la hidrólisis por las betalactamasas

tienen una actividad máxima frente a organismos grampositivos, cocos gramnegativos y anaerobios que no producen betalactamasas

### Penicilina G (IV)

Administración parenteral de penicilina G.

### Penicilina V (PO)

Administración oral de penicilinas G y V.

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 intramuscular. Las concentraciones séricas 30 minutos después de una inyección intravenosa de 1 g de penicilina G (equivalente a aproximadamente 1.6 millones de unidades) son 20-50 mcg/mL.

Las penicilinas benzatínicas y procainicas están formuladas para retrasar la absorción, lo que da como resultado concentraciones prolongadas en la sangre y los tejidos. Una sola inyección intramuscular de 1.2 millones de unidades de penicilina benzatínica mantiene los niveles séricos por encima de 0.02 mcg/mL durante 10 días, suficiente para tratar las infecciones por estreptococos beta hemolíticos.

### Penicilinas antiestafilocócicas

Son resistentes a las betalactamasas estafilocócicas. Son activos contra los estafilococos y los estreptococos.

### Cloxacilina, dicloxacilina (PO)

Una isoxazolil penicilina como dicloxacilina, 0.25-0.5 g por vía oral cada 4-6 horas (15-25 mg/kg/d para niños), es adecuada para el tratamiento de infecciones estafilocócicas localizadas de leves a moderadas.

### Oxacilina (IV)

La oxacilina y la nafcilina, 8-12 g/d, administrados por infusión intravenosa intermitente de 1-2 g cada 4-6 horas (50-200 mg/kg/d para niños), se consideran medicamentos de elección para infecciones estafilocócicas graves como la endocarditis

La meticilina, la primera penicilina antiestafilocócica que se desarrolló, ya no se usa clínicamente debido a las altas tasas de efectos adversos

### Nafcilina (IV)

La oxacilina y la nafcilina, 8-12 g/d, administrados por infusión intravenosa intermitente de 1-2 g cada 4-6 horas (50-200 mg/kg/d para niños), se consideran medicamentos de elección para infecciones estafilocócicas graves como la endocarditis

### Penicilinas de amplio espectro

retienen el espectro antibacteriano de la penicilina y tienen actividad mejorada contra los bacilos gramnegativos.

### Piperacilina/tazobactam (IV)

### Amoxicilina/clavulanato de potasio (PO)

### Amoxicilina (PO)

### Ampicilina

La ampicilina, en dosis de 4-12 g/d por vía intravenosa, es útil para tratar infecciones graves causadas por organismos susceptibles, incluidos anaerobios, enterococos, *L. monocytogenes* y cepas betalactamasas negativas de cocos gramnegativos y bacilos como *E. coli*, y *Salmonella*

## Dosis

Antibiótico (vía de administración)	Dosis para adultos	Dosis pediátrica <sup>2</sup>	Dosis ajustada a un porcentaje de la dosis normal para la insuficiencia renal basada en la eliminación de creatinina (CL <sub>cr</sub> )		
			CL <sub>cr</sub> aprox 50 mL/min	CL <sub>cr</sub> aprox 10 mL/min	
<b>Penicilinas</b>					
Penicilina G (IV)	1.4 x 10 <sup>6</sup> unidades q4-6h	25 000-400 000 unidades/kg/d en 4-6 dosis	75 000-150 000 unidades/kg/d en 2 o 3 dosis	50-75%	25%
<b>Penicilinas antiestafilocócicas</b>					
Penicilina V (PO)	0.25-0.5 g qid	25-75 mg/kg/d en 4 dosis		Ninguna	Ninguna
Cloxacilina, dicloxacilina (PO)	0.25-0.5 g qid	15-25 mg/kg/d en 4 dosis		100%	100%
Nafcilina (IV)	1-2 g q4-6h	100-200 mg/kg/d en 4-6 dosis	50-75 mg/kg/d en 2 o 3 dosis	100%	100%
Oxacilina (IV)	1-2 g q4-6h	50-100 mg/kg/d en 4-6 dosis	50-75 mg/kg/d en 2 o 3 dosis	100%	100%
<b>Penicilinas de amplio espectro</b>					
Ampicilina (PO)	0.25-0.5 g tid	20-40 mg/kg/d en 3 dosis		66%	33%
Amoxicilina/clavulanato de potasio (PO)	500/125 mg 8/8/125 mg dos veces	20-40 mg/kg/d en 3 dosis		66%	33%
Piperacilina/tazobactam (IV)	3.375-4.5 g q4-6h	300 mg/kg/d en 4-6 dosis <sup>3</sup>	150 mg/kg/d en 2 dosis <sup>3</sup>	50-75%	25-33%

## Efectos adversos

- Hipersensibilidad
- Las reacciones alérgicas incluyen choque anafiláctico
- Malestar gastrointestinal, especialmente náuseas, vómitos y diarrea

La amoxicilina, 250-500 mg tres veces al día, es equivalente a la misma cantidad de ampicilina administrada cuatro veces al día.

se administra por vía oral para tratar la sinusitis bacteriana, la otitis y las infecciones del tracto respiratorio inferior.

# CEFALOSPORINAS DE PRIMERA GENERACIÓN

Las Cefalosporinas son antibióticos Beta-Lactámicos muy parecidos a las penicilinas, sólo que estas tienen la ventaja sobre muchas betalactamasas bacterianas teniendo un espectro de actividad más amplia.

## Mecanismo de acción

actúan inhibiendo la síntesis de la pared celular

## Cefalosporinas de primera generación 6 compuestos dentro de la agrupación

CEFAZOLINA

CEFADROXILO

CEFALOTINA

CEFALEXINA

CEFRADINA

CEFAPIRINA

## Farmacocinética

Oral: Cefalexina

Parenteral: Cefazolina (IV)

Dosis para adultos

Dosis pediátrico

Dosis para adultos

Dosis pediátrico

0.25-0.5g qid  
Cuatro veces al día

25-50mg/kg/d  
en 4 dosis

0.5-2 g q8h

25-100 mg/kg/d  
en 3 o 4 dosis

## Espectro antibacterial contra

- Estreptococos
- Staphylococcus aureus
- algunos Proteus
- E. coli,
- Klebsiella

**Es un fármaco de elección para la profilaxis quirúrgica y para muchas infecciones estreptocócicas y estafilocócicas que requieren terapia intravenosa**

# CEFALOSPORINAS SEGUNDA GENERACION

son antibióticos betalactámicos bactericidas

## Mecanismo de acción

Inhiben enzimas de la pared celular de las bacterias sensibles e interrumpen su síntesis

## Clasificación

- Cefactor
- Cefamandol
- Cefonicida
- Cefuroxi ma
- Cefprozil
- Loracarbef
- Ceforanida

## Farmacocinética

### Oral:

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

### Parental:

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

## Espectro antibacterial contra

Escherichia coli, Klebsiella, Proteus, Haemophilus influenzae, Moraxella catarrhalis, Citrobacter, Enterobacter; Serratia; Neisseria gonorrhoeae; actividad para S. aureus, Streptococcus pneumoniae y Streptococcus pyogenes comparable a los agentes de primera generación. Actividad contra Bacteroides spp. inferior al de la cefoxitina y el cefotetán.

# CEFALOSPORINAS DE TERCERA GENERACIÓN

son antibióticos betalactámicos bactericidas

## Mecanismo de acción

Inhiben enzimas de la pared celular de las bacterias sensibles e interrumpen su síntesis

## Clasificación

## Farmacocinética

## Espectro antibacterial contra

CEFTAZIDIMA

La dosificación habitual para adultos es de 1 g administrado por vía I.V. o i.M., cada 8 a 12 horas.

CEFOPERAZONE

La vida media plasmática es de 2 horas, dosis adulto: 1 a 2 grs c/24 hrs, niños 20 a 40 mgs x kilo cada 24 hrs. intravenos/intramuscular

penetran bien en la mayoría de los líquidos corporales y en el líquido extracelular de la mayoría de los tejidos, en especial cuando hay un proceso inflamatorio que favorece la difusión

Escherichia coli, Klebsiella, Proteus, Haemophilus influenzae, Moraxella catarrhalis. No tan activo contra organismos grampositivos como los agentes de primera generación

Actividad inferior contra S. aureus en comparación con la cefuroxima, pero con actividad adicional contra Bacteroides fragilis y otros Bacteroides spp.

CEFTRIAXONA

(semivida de 7-8 horas) se puede inyectar una vez cada 24 horas a una dosis de 15-50 mg/ kg/d

CEFDINIR

Después de una dosis oral de 300 mg de cefdinir, las concentraciones plasmáticas máximas se producen a las 2 a 4 horas.

CEFOTAXIMA

La vida media de eliminación es de 1 hora. Dosis 1 g de cefotaxima cada 12 horas. En infecciones graves o con riesgo vital puede aumentarse la dosis hasta 12 g diarios (dosis máxima diaria) divididos en 3-6 dosis.

CEFTIBUTEN

Dosis usual en adultos: 400 mg al día o 200 mg cada 12 horas, dosis usual en niños de más de 45 kg de peso o mayores de 10 años, la posología puede ser igual que en los adultos. dosis usual en niños mayores de 6 meses hasta 10 años o con peso menor a 45 kg de peso: 9 mg por kg de peso al día, repartido en dos tomas.

# Carbapenémicos

Son antibióticos de la subclase de antibióticos beta-lactámicos (antibióticos que tienen una estructura química llamada anillo beta-lactámico).

## Clasificación

### Imipenem

#### Actividad antimicrobiana

se une a las proteínas de unión a la penicilina, interrumpe la síntesis de la pared bacteriana y causa la muerte de microorganismos susceptibles. Es muy resistente a la hidrólisis por parte de la mayoría de las  $\beta$ -lactamasas

#### Usos terapéuticos.

La combinación de imipenem y cilastatina es eficaz contra muy diversas infecciones como las de las vías urinarias y respiratorias inferiores, las intraabdominales y del aparato reproductor de la mujer, y de piel, tejidos blandos, huesos y articulaciones

#### Farmacocinética y reacciones adversas

No se absorbe cuando se administra por vía oral. Es hidrolizado rápidamente por la dipeptidasa que se encuentra en el borde en cepillo del túbulo renal proximal. En la orina son bajas las concentraciones del fármaco activo y por eso se sintetizó la cilastatina

### Meropenem

No necesita combinarse simultáneamente con la cilastatina, porque no es sensible a la dipeptidasa renal. Sus efectos tóxicos son similares a los del Imipenem, excepto en que existe menor posibilidad de que cause convulsiones

### Doripenem

El doripenem tiene un espectro de actividad similar al del Imipenem y el meropenem, aunque su actividad es mayor contra algunas variedades resistentes de *Pseudomonas*

### Ertapenem

Difiere del Imipenem y del meropenem porque posee una semivida más larga que permite administrarlo sólo una vez al día y su actividad es inferior contra *P. aeruginosa* y especies de *Acinetobacter*

## Efectos adversos

- Náuseas
- Vómito
- Diarrea
- Erupciones cutáneas
- Reacciones de hipersensibilidad

## Dosis

### Imipenem

0.25 – 0.5g vía intravenosa cada 12 – 24 horas

### Meropenem

0.5 – 1g vía intravenosas cada 12 horas

### Doripenem

0.5 con una infusión 1-4 horas cada 12 horas

### Ertapenem

1g por vía intravenosa

# Monobactamicos

Los monobactamicos son fármacos con un anillo de betalactama monocíclico. Su espectro de actividad se limita a organismos aeróbicos gramnegativos (incluyendo P. aeruginosa).

## Aztreonam

### Mecanismo de acción

Es bactericida y su mecanismo de acción es similar al de las penicilinas y cefalosporinas

### Actua contra

E. Coli

Serratia

Salmonela

Shigella

### 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. Los pacientes alérgicos a la penicilina toleran el aztreonam sin reacción.

### Efectos adversos

- Pueden producir reacciones cutáneas
- Los efectos adversos más frecuente en SNC son : Cefalea, mareo, agitación, somnolencia y depresión

### NOTA:

En pacientes con antecedentes de anafilaxia por penicilina, el aztreonam puede usarse para tratar infecciones graves como neumonía, meningitis y sepsis causadas por patógenos

# Aminoglucósidos

Son utilizados para tratar infecciones bacterianas graves, como las que son causadas por bacterias gramnegativas.

## Mecanismo de acción

Los antibióticos aminoglucósidos son bactericidas de acción rápida. La destrucción de las bacterias depende de la concentración. Los aminoglucósidos se difunden a través de canales acuosos formados por proteínas de porina en la membrana externa de las bacterias gramnegativas para ingresar al espacio periplasmático.

## Clasificación

## Efectos adversos

Todos los aminoglucósidos son ototóxicos y nefrotóxicos. Es probable encontrarlo cuando la terapia se continúa por más de cinco días, en dosis más altas, en ancianos y ante un contexto de insuficiencia renal.

## Farmacocinética

Generalmente se administran por vía intravenosa en forma de infusión durante 30-60 minutos.

En situaciones clínicas es preferible la dosis diaria completa en una sola inyección.

### Estreptomicina.

Se usa como un agente de segunda línea para el tratamiento de la tuberculosis.

La dosis es de 15 mg/kg/día, con un máximo de 1 g/día y para niños es de 20-40 mg/kg/día para niños.

### Neomicina.

La neomicina generalmente se limita al uso tópico y oral debido a la toxicidad asociada con el uso parenteral y las tasas de resistencia más altas en comparación con otros aminoglucósidos

### Kanamicina.

Administración intravenosa e intramuscular. Cuando se usa por vía intravenosa, la dosis estándar para la kanamicina es de 15 mg/kg/día en 2-3 dosis divididas

### Amikacina

Muchas bacterias gramnegativas, incluidas muchas cepas de Proteus, Pseudomonas, Enterobacter y Serratia, son inhibidas por 1-20 mcg/mL de amikacina in vitro. Después de una inyección de 500 mg de amikacina cada 12 horas (15 mg/kg/d) por vía intramuscular, los niveles máximos en suero son de 10-30 mcg/mL.

### Gentamicina.

Se usa en infecciones graves causadas por bacterias gramnegativas, que probablemente sean resistentes a otros fármacos

### Tobramicina

Tiene un espectro antibacteriano similar al de la gentamicina.

Las dosis diarias de tobramicina son de 5-7 mg/kg, por vía intramuscular o intravenosa. Por lo general dividida en tres cantidades iguales o administradas cada 8 hora. Aunque ahora se indica como una sola dosis diaria.

### Sisomicina.

### Netilmicina.

### Plazomicina.

Tiene una actividad similar a la gentamicina contra estafilococos. Una dosis de 15 mg/kg produce concentraciones medias máximas de 113 mcg/mL, y mínimas de 0.43 mcg/mL. La semivida es de aproximadamente 4 horas y se está estudiando como una sola dosis diaria.

## Bibliografía

1. Farmacología básica y clínica. Editado por Bertram G. Katzung, MD, PhD, Professor Emeritus, Department of Cellular & Molecular, Pharmacology, University of California, San Francisco. Decimocuarta edición
2. Goodman & Gilman Las Bases Farmacológicas de la Terapéutica 13ª. Penicilinas, cefalosporinas y otros antibióticos lactámicos, aminoglucósidos