

Universidad Autónoma del Estado de México

Facultad de Medicina

Unidad de Aprendizaje: Farmacología

Programa Educativo: Médico Cirujano

Espacio Académico: Facultad de Medicina

Responsable de la Elaboración: M.A.M. Ricardo Paulino José Gallardo Díaz

Fecha de elaboración: Septiembre de 2015

Guion Explicativo

La Unidad IV de la Unidad de Aprendizaje de Farmacología de la Licenciatura de Médico Cirujano, comprende *FARMACOLOGÍA DE LOS ANTIMICROBIANOS* entre los que se encuentra la Subunidad número 4.2.

DIAPOSITIVA NUMERO	DESCRIPCIÓN
1	<p>Presentación: UNIVERSIDAD AUTÓNOMA DEL ESTADO DE MÉXICO Facultad de Medicina Título: SULFAS, SULFONAS, TRIMETOPRIM Y COMBINACIONES; USOS CLÍNICOS</p> <p>Unidad de Aprendizaje: Farmacología Programa educativo: Médico Cirujano Espacio educativo: Facultad de Medicina Responsable de la elaboración: M.A.M. Ricardo Paulino Gallardo Díaz</p>
2	<p>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.</p> <p>Son compuestos derivados sintéticos de la paraaminobenzenosulfamida: (SULFANILAMIDA) que contiene un núcleo benceno con un grupo amino (NH₂) y otro amida (SO₂NH₂). Las sulfas tienden a ser más solubles en pH alcalino</p>
3	<p>Se muestra la fórmula básica de las sulfonamidas, que es similar al ácido para-amino benzoico (PABA), a partir de este compuesto se obtienen la gran diversidad de sulfas y sulfonas, al añadir sustituyentes en los grupos amida (SO₂NH) y amina (NH₂) del núcleo de la paraaminobenzenosulfamida-sulfanilamida</p>
4	<p>Se muestra la fórmula química del SULFAMETOXASOL, en donde se muestra claramente los sustituyentes en el grupo amida, destacando que para conservar la actividad</p>

	antimicrobiana el grupo amina debe estar libre, en posición 4 (encerrada en un círculo de color rojo)
5	<p>Se muestra la CLASIFICACIÓN DE LAS SULFAS:</p> <ul style="list-style-type: none"> ▶ SULFISOXAZOL y SULFAMETOXAZOL. Se absorbe y excreta con rapidez. Son fármacos de acción breve a intermedia que se emplean en el tratamiento de infecciones de vías urinarias ▶ SULFADIACINA + PIRIMETAMINA, se emplean en toxoplasmosis ▶ SULFADOXINA. Acción prolongada. V.O. Paludismo ▶ SULFASALAZINA. Absorción escasa por V.O., consideradas como NO absorbibles, se emplean en colitis ulcerosa, enteritis y otras colitis ▶ SULFACETAMIDA. Uso local -tópico- en oftalmología <p>Hasta hace algunos años las sulfas se empleaban de manera extensa en clínica, pero con el advenimiento de otros antimicrobianos más potentes y menos tóxicos su uso ha disminuido</p>
6	De las sulfas absorbibles cuando se administran por vía oral, su absorción es la adecuada a pH alcalino, siendo la fracción biodisponible de un 70-90% de la dosis. Las sulfas por V.O. se clasifican en: acción corta, acción intermedia y acción prolongada
7	Las sulfas sufren biotransformación hepática, a través de una acetilación y glucoronconjugación, dando origen a metabolitos inactivos que se excretan con el filtrado glomerular
8	Distribución. Las sulfas se conjugan en un 20-90% con proteínas plasmáticas. El esquema ilustra tal unión. Alcanza su pico más alto 2-6 hrs después de la administración
9	Mecanismo de acción. Las sulfonamidas son antimicrobianos antifolatos, ejercen acciones bacteriostáticas. Actúan sobre las bacterias en crecimiento impidiendo la síntesis del ácido fólico. <i>Son análogos estructurales del PABA, las sulfas inhiben a la dihidropteroato sintetasa y por tanto la síntesis de folato; no hay purinas para la formación del ADN</i>
10	Se presenta de manera interactiva el mecanismo de acción de las sulfas. Las bacterias sensibles a las sulfas requieren al PABA para sintetizar el ácido fólico el cual por acción de la enzima dihidropteroato sintetasa finalmente interviene para la síntesis de ácido tetrahidrofólico y estos a su vez producen purinas que intervienen en la genética bacteriana –ADN-
11	FARMACODINAMIA. Efecto BACTERIOSTÁTICO. El resultado final de las alteraciones en la síntesis de ácido fólico es una disminución en la síntesis de purinas y estas a su vez limitan la producción de nucleótidos, con la consiguiente inhibición del crecimiento bacteriano

12	<p>ACCIONES FARMACOLÓGICAS. ESPECTRO ANTIBACTERIANO. Las sulfamidas actúan contra bacterias grampositivas y gramnegativas.</p> <p>Los microorganismos más sensibles son: Chlamydia trachomatis, Haemophilus influenzae, Nocardia asteroides, Sptreptococcus pyogenes, Mycobacterium leprae, Histoplasma capsulatum Paracoccicoides brasiliensis</p>
13	<p>Actividad antimicrobiana. Bacterias susceptibles: Bacterias Gram(+) y Gram (-) y algunos protozoarios, Bacterias entéricas, Infecciones primarias de vías urinarias, Nocardosis y Toxoplasmosis</p>
14	<p>Usos terapéuticos: Infecciones de las vías urinarias, Disenteria bacilar (shiguelosis), Infecciones meningococcicas, Nocardosis, Tracoma y conjuntivitis por exclusión, Linfogranuloma venéreo, Toxoplasmosis</p>
15	<p>Reacciones adversas: Trastornos del sistema hematopoyético: ANEMIA HEMOLÍTICA AGUDA, AGRANULOCITOSIS, ANEMIA APLÁSTICA, TROMBOCITOPENIA, EOSINOFILIA</p> <p>Reacciones de hipersensibilidad: LESIONES VASCULARES Y TRASTORNOS CUTANEOS Y MUCOSOS</p>
16	<p>Efectos no deseados, incompatibilidades e interacciones. Se manifiesta por una reacción maculopapulosa pruriginosa siendo mayor en personas infectadas con el virus del VIH.</p>
17	<p>En algunos pacientes puede ocasionar foto sensibilización, nauseas, vómitos, cefaleas y depresión</p> <p>Rara vez produce Síndrome de Stevens-Johnson o necroepidermólisis tóxica</p> <p>Foto. Se muestra la imagen de un niño con un Síndrome de Stevens-Johnson provocado por sulfas, se aprecian las lesiones necróticas en el tórax</p>
18	<p>Se comentan como reacciones adversas, que en pacientes con carencia de glucosa-6-fosfato deshidrogenasa pueden haber reacciones hematológicas como: agranulocitosis, trombocitopenia, leucopenia, y anemia hemolítica</p> <p>En cuanto el tracto urinario puede producir cristaluria, que se evita aumentando la ingesta de líquidos</p>
19	<p>CRISTALURIA POR SULFAS. DAN UN COLOR MARRON A LA ORINA.</p> <p>Puede ocurrir cristaluria nefrotóxica con:</p> <ol style="list-style-type: none"> 1) Primitivas preparaciones de sulfas, menos solubles 2) Volúmenes urinarios bajos por deshidratación o enfermedad renal 3) pH urinario bajo <p>Se muestra un riñón y la orina con huellas de cristaluria, que da un color marrón</p>

20	<p>No debe administrarse durante los últimos meses del embarazo, ya que desplaza la albúmina de la bilirrubina; produciendo por tanto hiperbilirrubinemia en el feto con riesgo de Kernicterus.</p> <p>La encefalopatía por bilirrubinas es un síndrome neurológico que resulta del depósito de bilirrubina no conjugada en el sistema nervioso central (SNC), especialmente en los ganglios basales y núcleos del tallo cerebral</p> <p>Se muestran fotografías de dos fetos</p>
21	<p>Subtítulo: TRIMETOPRIM</p> <p>En un principio se usó en dosis tóxicas, pero posteriormente se observó que asociada a una sulfamida tenía efectos sinérgicos. Al actuar sobre la misma vía del metabolismo del ácido fólico, el Trimetoprim presenta acción sinérgica con las sulfonamidas</p>
22	<p>Es una trimetoxibenzilpirimidina</p> <p>Es un antibacteriano del grupo de las Diaminopiridinas con acción bacteriostática. Es un inhibidor de la dihidrofolatorreductasa bacteriana.</p> <p>Es casi 50 000 veces menos eficaz para la inhibición de la ácido dihidrofolatorreductasa de los mamíferos-</p> <p>El resultado final es la inhibición de la síntesis de ADN y proteínas bacterianas</p>
23	<p>Es activa frente a los patógenos bacterianos más comunes exceptuando Pseudomona aeruginosa, y especies de bacteroides , la mayoría de los anaerobios, Treponema, Mycobacterium y Mycoplasma son resistentes</p> <p>Se muestra la imagen de unos bacteroides</p>
24	<p>Farmacodinamia. Efecto bacteriostático. El trimetoprim es un inhibidor competitivo de la dihidrofolato reductasa que es una enzima necesaria para el paso de dihidrofolato a tetrahidrofolato que es el cofactor necesario para la síntesis de DNA</p>
25	<p>Se muestra de manera interactiva el mecanismo de acción del trimetoprim, destaca la inhibición de la dihidrofolatorreductasa bacteriana, que es necesaria para la síntesis de folatos –ácido tetrahidrofólico</p>
26	<p>Farmacocinética. Se administra por V.O. o I.V. solo o en combinación con el sulfametoxazol. Se absorbe bien en el intestino delgado. Su volumen de distribución es grande, se concentra en líquido prostático y vaginal</p> <p>Se metaboliza en el hígado produce metabolitos que conservan la acción bacteriostática, se elimina por orina el 80 % de forma inalterada</p>
27	<p>Este medicamento penetra la próstata siendo útil en el tratamiento de la prostatitis crónica bacteriana.</p> <p>Se muestra la imagen del pene, del cual sale una gota de material purulento a través de la uretra, propio de la gonorrea.</p>

	La cual cuando es maltratada puede complicarse en una prostatitis
28	TRIMETOPRIMA-SULFAMETOXAZOL (BACTRIM) Es una combinación sinérgica en la proporción 5 a 1 de trimetoprima- sulfametoxazol respectivamente. presentación en México 400 y 80 Mg. de sulfametoxazol 800 y 160 Mg. de trimetoprima respectivamente Suspensión: cada 5 ml contiene 200 Mg. de sulfametoxazol y 40 Mg. de trimetoprima
29	Basados en la experiencia clínica se deberá considerar a los siguientes microorganismos como sensibles: Brúcela, Chlamydia trachomatis, Nocardia asteroides, Pneumocystis carinii
30	INDICACIONES TERAPÉUTICAS Infecciones del tracto respiratorio: Bronquitis crónica, tratamiento y profilaxis primaria y secundaria de neumonía por Pneumocystis carinii. Infecciones del tracto urogenital : Uretritis gonocócica y chancroides
31	Infecciones del tracto gastrointestinal como: fiebre tifoidea y para tifoidea, shigellosis (tipo S. flexneri y S. sonéis); diarrea del viajero causada por Escherichia coli enterotoxigénica y cólera Se muestra una fotografía del Vibrión colérico
32	Infecciones de vías urinarias: 1. Infecciones urinarias no complicadas (por patógenos no resistentes). Es de primera elección 2. IVU crónica o recurrente (por patógeno sensible) 3. Prostatitis, orquitis y epididimitis.
33	Infecciones respiratorias. 1. Exacerbaciones agudas de la bronquitis crónica. 2. Neumonía por Legionella y Pneumocystis Carinii. 3. Nocardiosis, ya sea pulmonar o en otros órganos. 4. Granulomatosis de Wegener, (limitada a pulmón o sin vasculitis diseminada) 5. Neumonía Adquirida en la Comunidad (Aunque hay muchos neumococos resistentes)
34	Uso en otorrinolaringología: 1. Sinusitis aguda. 2. Otitis media aguda.
35	Tubo digestivo: 1. Diarrea del viajero causada por E. Coli productora de enterotoxinas. 2. Shigellosis, isosporiasis , ciclosporiasis, fiebre tifoidea (Salmonela) y diarrea por Vibrio Cólera.

	Profilaxis de los pacientes con alto riesgo de desarrollar peritonitis bacteriana primaria.
36	Se muestra la fotografía de un ojo con tracoma. Es provocada por Clamidia Trachomatis, la infección se propaga a través del contacto directo con el ojo o nariz infectados o las secreciones de la garganta y destaca la opacidad de la córnea, susceptible de ser tratada con sulfas
37	Se presenta una Tele de Tórax en la que se muestra la imagen de una neumonía por Clamidia Trachomas, que debe ser tratada con sulfas
38	Corresponde a una imagen de linfogranuloma venéreo en una persona del sexo masculino, destaca la reacción inflamatoria. Debe de tratarse con sulfas o tetraciclina, doxiciclina, eritromicina y/o azitromicina
39	Una imagen al margen para agradecer a quienes vean el material ¡GRACIAS!