

DEXACILINA

Suspensión Inyectable.

Reg Sagarpa Q-1110-009



DEXACILINA

Fórmula:

Penicilina G procaína 200,000 UI

Dihidroestreptomicina base 200 mg

Dexametasona acetato 0.5 mg

Vehículo c.b.p 1 ml

Dexametasona: Glucocorticoide sintético derivado del cortisol con una actividad antiinflamatoria 25 veces mayor que éste, y sin actividad mineral corticoide.

Tiene multitud de efectos en el organismo, que se pueden resumir en:

A.- Efectos sobre el metabolismo.

Su acción gluconeogénica provoca un aumento del depósito de glucosa en la sangre y del glucógeno en el hígado. El nivel del glucógeno hepático aumenta a expensas la movilización de las grasas y del catabolismo de las proteínas. Debido a éste, aumenta el nivel de aminoácidos en sangre.

B.- Efectos antiinflamatorios.

Disminuye el grado de inflamación local debido a la inhibición de la fosfolipasa A2 que libera ácido araquidónico (precursor de prostaglandinas) a partir de las membranas lipídicas, estabilizándose así la membrana de los liposomas (orgánulos intracelulares que contienen proteasas y enzimas hidrolíticas) y por lo tanto su desintegración, que es responsable del daño celular en los procesos inflamatorios. Disminuye asimismo la reacción vascular y celular del foco inflamatorio.

La presencia de eosinófilos en la mucosa respiratoria es uno de los hallazgos histológicos más frecuentes en las enfermedades inflamatorias de la mucosa respiratoria independientemente de su origen.

* *El tratamiento con Dexametasona Presente en DEXACILINA, aún a dosis elevadas, o inferior a una semana suelen cursar sin efectos adversos y favoreciendo de forma sustancial la evolución positiva de los procesos infecciosos cuando se asocia a los antibióticos presentes en esta especialidad.*

La Dexametasona presente en la Dexacilina también inhibe la exudación de plasma en las zonas inflamadas, así como la secreción mucosa mediante un mecanismo de acción en el que parece intervenir la lipocortina. Es de los fármacos más potentes y más efectivos empleados en el tratamiento y la prevención de la inflamación

El efecto antialérgico se debe a la inhibición de la liberación de mediadores químicos que intervienen en el proceso inflamatorio (ej.: histamina).

C.- Efecto sobre la secreción de ACTH

Inhibe su secreción, por represión de la CRH (Hormona liberadora de Corticotropina) del hipotálamo.

MECANISMO DE ACCIÓN:

Las sales hidrosolubles de la dexametasona (fosfato sódico, m-sulfobenzoato, etc.) son compuestos que se absorben rápidamente desde el punto de inoculación consiguiendo una concentración máxima en sangre a los pocos minutos de su administración por vía IM. Su efecto terapéutico en el organismo tiene una duración aproximada de 24-48 horas.

Después de su absorción tras la administración parenteral la dexametasona se difunde por todo el organismo, uniéndose en su mayor parte a proteínas plasmáticas.

La unión a proteínas sirve de depósito desde el cual los corticoides se liberan para pasar a su forma libre y difundir así a todos los tejidos, donde son metabolizados, formándose los tetrahydroderivados por reducciones sucesivas, los cuales dan lugar a:

- 17-hidroxicorticoides (sin actividad biológica)
- 17-cetoesteroides (con propiedades androgénicas)

Además, se conjugan con ácido glucurónico, y en menor proporción, con sulfatos en hígado y riñón, dando los glucurónidos y (ésteres

sulfúricos hidrosolubles, que se excretan rápidamente por la orina (75%). La eliminación por bilis ocurre en un 25 %.

Aumenta el número de hematíes al inhibir su autodestrucción, y el de leucocitos polimorfonucleares al aumentar su liberación por la médula ósea y disminuir su eliminación

- * ***La Dexametasona incrementa el efecto de la asociación antibiótica al romper la barrera inflamatoria, permitiendo una mayor penetración de los fármacos, con lo que se obtiene una respuesta favorable del organismo más rápida y elevada.***

La Dexacilina a la acción de la Dexametasona suma la asociación de Penicilina G Procaína y Dihidroestreptomicina logra un efecto bactericida sobre bacterias Gram + y Gram -.

Mecanismo de acción: La Penicilina G Procaína actúa bloqueando la biosíntesis de la pared bacteriana. Se fija por unión covalente tras la apertura del núcleo betalactámico, sobre ciertas proteínas enzimáticas PBP (transpeptidasas). La penicilina únicamente es activa sobre bacterias en fase de multiplicación.

La dihidroestreptomicina actúa fijándose sobre la unidad 30S de los ribosomas. Impide sobretodo la fase de iniciación, perturbándose la ordenación del RNA mensajero y provocando una lectura incorrecta del código genético por el RNA de transferencia. Perturba además la permeabilidad de la membrana bacteriana.

Con la asociación de ambos compuestos se logra un sinergismo debido a un primer efecto de la penicilina sobre la pared celular bacteriana permitiendo la penetración de la dihidroestreptomicina más fácilmente dentro de la célula, aumentando por tanto, la eficacia de los dos compuestos por separado.

Farmacocinética: Tras la administración intramuscular, la Penicilina G Procaína se libera de manera prolongada desde el punto de inyección, produciendo una concentración máxima en la sangre al cabo de 1-3 horas de su administración (según especies). Se fija

débilmente a las proteínas plasmáticas en una proporción del 45 al 65 %, y los niveles terapéuticos en sangre persisten 24 horas.

La dihidroestreptomicina, sin embargo, se absorbe rápidamente a partir del punto de inoculación, alcanzando las concentraciones más altas en sangre al cabo de 1 hora, absorbiéndose aproximadamente 2 veces más rápido que la Penicilina G Procaína, siendo su semivida biológica la mitad que la de esta última.

El pH óptimo de actividad de la Penicilina G Procaína es ligeramente ácido, de 5,5 a 6,5. Se distribuye ampliamente por todo el organismo, pero la concentración en los distintos tejidos corporales difiere, alcanzándose cantidades significativas del fármaco en pulmón, riñón, hígado, piel y contenido intestinal y observándose concentraciones reducidas en áreas escasamente vascularizadas, como córnea, cartílagos y huesos.

Atraviesa la placenta y penetra lentamente en la circulación fetal desde la madre. Se metaboliza parcialmente en ácido peniciloico, pero en su mayor parte (90%) se elimina por la orina en forma inalterada. También aparece en pequeñas cantidades en la leche de las hembras en lactación.

Con respecto a la dihidroestreptomicina, se distribuye preferentemente por los espacios extracelulares del organismo y no se une apenas a las proteínas plasmáticas (menos del 10 %) penetrando mínimamente en la mayoría de los tejidos excepto el riñón (volumen de distribución relativamente pequeño: 0,35 a 0,45 L/kg).

Se obtienen buenas concentraciones en los líquidos de las cavidades corporales.

Atraviesa la barrera hematoencefálica y la placentaria, así como articulaciones y globo ocular, pero no consigue en ellos concentraciones terapéuticas ni tampoco en secreciones bronquiales, líquido intestinal, secreciones prostáticas, bilis y leche. Se excreta en un 50-60 % por la orina, de forma inalterada, y un 2-5 % se elimina por bilis.

Espectro de la Dexacilina

Corynebacterium spp., Streptococcus spp., Staphylococcus spp., Clostridium spp., Bacillus anthracis, Erysipelothrix spp., Nocardia spp., Listeria spp., Vibrio spp., Actinomyces spp.

Fusobacterium necrophorum, Pasteurella spp., Actinobacillus spp., Proteus spp., Neisseria spp.

Algunas *Rickettsias, Leptospira spp.*, espiroquetas (*Borrelia, Treponema*).

Escherichia coli, Klebsiella spp., Shigella spp., Proteus spp. (algunas especies), *Salmonella spp.* (algunas especies), *Yersinia spp., Pasteurella spp.* (algunas especies), cepas de *Actinomyces bovis, Leptospira spp., Mycobacterium spp., Haemophilus spp., Brucella spp., Campylobacter fetus.*

Eficaz en la prevención de enfermedades secundarias al destete como neumonías y diarreas, disminuyendo de manera eficiente la inapetencia generada por el estrés