

PENICILINA G SÓDICA KLONAL

PENICILINA G SÓDICA

Injectable

Venta bajo receta archivada

Industria Argentina

K-37/G

Fórmula cuali y cuantitativa:

Cada frasco ampolla contiene:

Penicilina G Sódica	500.000 U.I.
Penicilina G Sódica	1.000.000 U.I.
Penicilina G Sódica	2.000.000 U.I.
Penicilina G Sódica	3.000.000 U.I.
Penicilina G Sódica	5.000.000 U.I.
Penicilina G Sódica	24.000.000 U.I.
Penicilina G Sódica	30.000.000 U.I.

ACCIÓN TERAPÉUTICA:

Antibiótico β-lactámico.

ACCIÓN FARMACOLÓGICA:

La penicilina G sódica ejerce una acción bactericida contra microorganismos sensibles a la penicilina durante el estado de multiplicación activa. Su acción bactericida es por inhibición de las síntesis de los mucopéptidos de la pared celular bacteriana, dejando a la misma osmóticamente inestable. No es activa frente a las bacterias productoras de penicilinasas, entre las cuales se incluyen muchas cepas de Estafilococos. Si bien los estudios in vitro han demostrado efectividad frente a la mayoría de las cepas de los siguientes microorganismos, no se ha documentado eficacia clínica en otras infecciones que no sean las nombradas en INDICACIONES. La penicilina G ejerce una alta actividad in vitro frente a Estafilococos (excepto las cepas productoras de penicilinasas), Estreptococos (Grupos A, C, G, H, L y M) y Neumococos. Otros microorganismos sensibles a la penicilina G son: *Neisseria gonorrhoeae*, *Corynebacterium diphtheriae*, *Bacillus anthracis*, *Clostridios*, *Actinomyces bovis*, *Streptobacillus moniliformis*, *Listeria monocytogenes* y *Leptospira*. El *Treponema Pallidum* es extremadamente sensible a la acción bactericida de la penicilina G. Algunas especies de bacilos Gram negativos son sensibles a concentraciones de moderadas a altas de la droga, obtenidas con administraciones endovenosas. Estos incluyen la mayor parte de las cepas de *Escherichia coli*, todas las cepas de *Proteus mirabilis*, *Salmonella* y *Shigella* y algunas cepas de *Aerobacter Aerógenes* y *Alcaligenes Faecalis*.

La Penicilina G actúa en forma sinérgica con la Gentamicina o la Tobramicina contra muchas cepas de Enterococos.

FARMACOCINÉTICA:

La Penicilina G se absorbe rápidamente tanto luego de una inyección intramuscular, como de una inyección subcutánea. Las concentraciones plasmáticas iniciales que siguen a las administraciones parenterales son altas pero transitorias. Las penicilinas se unen a proteínas séricas mayoritariamente a la albúmina. Los niveles terapéuticos de penicilina son fáciles de alcanzar en circunstancias normales en el fluido extracelular y la mayor parte de los demás tejidos. Las penicilinas están distribuidas en grados variables en los fluidos pleural, pericárdico, peritoneal, ascítico, sinovial e intersticial.

Las penicilinas son excretadas en leche materna. La penetración en el fluido cerebrospinal, ojos y próstata es pobre.

Las penicilinas son rápidamente excretadas en orina por filtración glomerular y secreción tubular renal activa, principalmente como droga inalterada.

Aproximadamente un 60 % de una dosis total de 300.000 unidades, es excretada en orina dentro de un período de 5 horas.

Por esta razón deben administrarse dosis altas y frecuentes para mantener las concentraciones séricas deseables para el tratamiento de ciertas infecciones severas en individuos con función renal normal. En neonatos y bebés pequeños, así como en pacientes con función renal disminuida, la excreción está considerablemente retardada.

INDICACIONES:

La Penicilina G acuosa (parenteral), está indicada en el tratamiento de infecciones severas causadas por microorganismos sensibles cuando se requieren niveles altos y rápidos. La terapia debería ser guiada por estudios bacteriológicos (incluyendo un test de sensibilidad) y por la respuesta clínica. Las siguientes infecciones usualmente responden a dosis adecuadas de penicilina G acuosa (parenteral): Infecciones estreptocócicas:

Los Estreptococos de los grupos A, C, G, H, L y M son muy sensibles a la Penicilina G. Algunos microorganismos del grupo D son sensibles a las altas concentraciones obtenidas con penicilina G acuosa. La Penicilina G acuosa es la forma de dosificación de elección para bacteriemia, empiemia, neumonía severa, pericarditis, endocarditis, meningitis y otras infecciones severas causadas por cepas sensibles de las especies Gram positivas mencionadas anteriormente.

Infecciones neumocócicas.

Infecciones estafilocócicas: para los microorganismos sensibles a la Penicilina G.

Otras infecciones: antrax, actinomicosis, infecciones por clostridios (incluyendo tétanos), para evitar el estado de portador de difteria, endocarditis erisipeloides (*Erysipelothrix insidiososa*).

Infección fusoespiroquética: infecciones severas de la orofaringe (Vincent's), tracto respiratorio inferior y área genital debidas a espiroquetas de *Fusobacterium fusiformis*.

Infecciones por bacilos Gram negativos (bacteriemias): *Escherichia coli*, *Proteus mirabilis*, *Salmonella*, *Shigella* y algunas cepas de *Aerobacter aerógenes* y *Alcaligenes faecalis*.

Meningitis y endocarditis por *Listeria (Listeria monocytogenes)*. Meningitis y bacteriemia por *Pasteurella (Pasteurella multocida)*. Fiebre por mordedura de rata (*Spirillum minus* o *Streptobacillus moniliformis*). Gonorrea, endocarditis y artritis (*Neisseria gonorrhoeae*).

Sífilis, incluso congénita (*Treponema Pallidum*).

Meningitis meningocócica.

A pesar de que no se han efectuado estudios clínicos controlados de eficiencia, la Penicilina G cristalina acuosa inyectable y la suspensión de Penicilina G procaína, han sido sugeridas por la Asociación Cardiológica Americana y por la Asociación Dental Americana, para ser usadas como parte de un régimen oral-parenteral combinado, para profilaxis contra endocarditis bacteriana en pacientes con enfermedad cardíaca congénita o enfermedad valvular reumática u otra enfermedad valvular adquirida, cuando son sometidos a procesos dentales o procesos quirúrgicos del tracto respiratorio superior. Dado que puede ocurrir que se encuentren Estreptococos alfa hemolíticos relativamente resistentes a la penicilina cuando el paciente está recibiendo penicilina oral continuamente para la prevención secundaria de fiebre reumática, pueden ser elegidos agentes profilácticos distintos a la penicilina para estos pacientes, y ser prescritos conjuntamente con su régimen habitual de profilaxis contra la fiebre reumática.

Previo a la terapia deben obtenerse especímenes para cultivo, con el objetivo de aislar e identificar el microorganismo causal y evaluar su sensibilidad a la Penicilina G sódica. La terapia puede instituirse antes de obtener los resultados del estudio de sensibilidad, sin embargo ésta debe adecuarse a estos resultados una vez que estos se conocen.

POSOLOGÍA:

Infecciones severas debidas a cepas sensibles de Estreptococos, Neumococos y Estafilococos: bacteriemia, neumonía, endocarditis, pericarditis, empiemia, meningitis y otras infecciones severas: un mínimo de 5.000.000 de unidades diarias.

Sífilis: La Penicilina G acuosa puede ser usada en el tratamiento de sífilis adquirida y congénita, pero por la necesidad de administración frecuente, se recomienda la hospitalización del paciente. La dosis y la duración de la terapia serán determinadas según la edad del paciente y el estado de la enfermedad.

Endocarditis gonoréica: un mínimo de 5.000.000 de unidades diarias.

Meningitis meningocócica: 1 a 2 millones de unidades vía intramuscular cada 2 horas o infusión endovenosa continua de 20 a 30 millones de unidades por día.

Actinomicosis: 1 a 6 millones de unidades diarias para casos cervicofaciales. 10 a 20 millones de unidades diarias para enfermedad torácica o abdominal.

Infecciones por clostridios: 20.000.000 de unidades diarias. La penicilina es una terapia adjunta a la administración de la antitoxina.

Infecciones fusoespiroquéticas: infecciones severas de la orofaringe, tracto respiratorio inferior y área genital: 5 a 10 millones de unidades diarias.

Fiebre por mordedura de rata (*Spirillum minus* o *Streptobacillus moniliformis*): 12 a 15 millones de

unidades diarias durante 3 a 4 semanas.

Meningitis y endocarditis por *Listeria (Listeria monocytogenes)*:

Neonatos: 500.000 a 1.000.000 de unidades diarias.

Adultos con meningitis: 15 a 20 millones de unidades diarias durante 2 semanas.

Adultos con endocarditis: 15 a 20 millones de unidades diarias durante 4 semanas.

Meningitis y bacteriemia por *Pasteurella (Pasteurella multocida)*: 4 a 6 millones de unidades diarias durante 2 semanas.

Endocarditis erisipeloides (*Erysipelothrix insidiosa*): 2 a 20 millones de unidades diarias durante 4 a 6 semanas.

Infecciones por bacilos Gram negativos (bacteriemias): *Escherichia coli*, *Proteus mirabilis*, *Salmonella*, *Shigella* y algunas cepas de *Aerobacter Aerógenes* y *Alcaligenes Faecalis*: 20 a 80 millones de unidades diarias.

Difteria (Estado de portador) 300.000 a 400.000 unidades diarias en dosis divididas durante 10 a 12 días.

Antrax: Un mínimo de 5.000.000 de unidades diarias en dosis divididas hasta que se haga efectiva la curación.

Para profilaxis contra endocarditis bacteriana en pacientes con enfermedad cardíaca congénita o enfermedad valvular reumática u otra enfermedad valvular adquirida, cuando son sometidos a procesos dentales o procesos quirúrgicos del tracto respiratorio superior, usar un régimen oral-parenteral combinado. Deberían administrarse 1.000.000 de unidades de Penicilina G acuosa cristalina (30.000 unidades/Kg en niños) por vía intramuscular, mezcladas con 600.000 unidades de Penicilina G Procaína (600.000 unidades para niños), 0,5 a 1 hora antes del procedimiento dental o quirúrgico. Deberían administrarse 8 dosis de penicilina V (fenoximetilpenicilina) de 500 mg para adultos o 250 mg para niños (cada 6 horas). Las dosis para niños no deberían exceder las dosis recomendadas para adultos para una dosis única o para un período de 24 horas.

Las soluciones de Penicilina G sódica pueden administrarse por vía intravenosa (como infusión endovenosa continua) e intramuscular en dosis de 500.000, 1.000.000, 2.000.000, 3.000.000 y 5.000.000. También es adecuada para instilación intrapleural, intraarticular y otras instilaciones locales. Las dosis mayores de 20.000.000 son para administración como infusión endovenosa continua únicamente.

Administración intramuscular: Mantener bajo el volumen de inyección total. La vía intramuscular es la vía de administración preferida. Las soluciones que contienen hasta 100.000 unidades por ml de Penicilina G sódica pueden ser administradas con un mínimo de molestia. Es físicamente posible la inyección de concentraciones mayores y éstas pueden usarse cuando la terapia lo demanda. Cuando se requieren dosis altas es recomendable aplicarlas por medio de una infusión endovenosa continua.

Se recomienda cambiar el sitio de inyección.

Administración por infusión intravenosa continua: Determinar el volumen de fluido y la velocidad de administración requerida por el paciente en un período de 24 hs, en la forma usual para terapia endovenosa continua, y añadir la dosis diaria apropiada de Penicilina G sódica a este fluido. Por ejemplo si un paciente adulto requiere 2 L. en un período de 24 horas, y una dosis diaria de 10.000.000 de unidades de penicilina, añadir 5.000.000 a un litro y ajustar la velocidad de flujo, de modo que el litro sea infundido en 12 horas.

Infusión intrapleural u otra infusión local: Si el fluido es aspirado, administrar la infusión en un volumen igual a 1/4 a 1/2 del volumen total aspirado, de otro modo preparar como para inyección intramuscular.

Uso intratecal: El uso intratecal de Penicilina G sódica en meningitis debe ser altamente individualizado. Debería ser empleada sólo con completa consideración de los posibles efectos irritantes de la penicilina cuando se la aplica por esta vía. La vía de administración preferida en meningitis bacteriana es la intravenosa, suplementada por inyección intramuscular.

RECONSTITUCIÓN Y MODO DE EMPLEO:

La penicilina G sódica es altamente soluble en agua y por lo tanto puede ser reconstituida disolviéndola en pequeñas porciones de agua estéril para inyección o solución isotónica estéril de cloruro de sodio para uso parenteral.

Todas las soluciones deben ser refrigeradas para su almacenamiento. Refrigeradas pueden ser almacenadas por 7 días sin pérdida significativa de la potencia.

Los productos de administración parenteral deben ser inspeccionados visualmente para detectar

partículas o decoloración, en forma previa a la administración, cuando la solución y el contenedor lo permitan.

CONTRAINDICACIONES:

Este medicamento está contraindicado en pacientes que presenten historial de alergia a las penicilinas. En caso de presentarse algún signo de hipersensibilidad, el producto debe ser discontinuado e instituirse una terapia adecuada.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Antes de la terapia con Penicilina G sódica, debe investigarse cuidadosamente si el paciente ha tenido anteriormente reacciones de hipersensibilidad a la Penicilina G sódica, penicilinas u otras drogas. Los antibióticos deben administrarse con cautela en aquellos pacientes que han experimentado algún tipo de alergia especialmente a los medicamentos. En caso de presentarse algún signo de hipersensibilidad, el producto debe ser discontinuado e instituirse una terapia adecuada, las reacciones de hipersensibilidad severas pueden requerir epinefrina subcutánea u otras medidas de emergencia. Han sido reportados casos serios y fatales por anafilaxia.

PRECAUCIONES:

Generales: La penicilina debe administrarse con cuidado en pacientes con historial de alergias significativas y/o asma.

Terapia intramuscular: Debe tenerse cuidado de no inyectar accidentalmente en forma endovenosa o intraarterial o en las cercanías de los principales nervios o vasos, dado que pueden producir daño neurovascular. Debe tomarse especial cuidado con la inyección endovenosa, ante la posibilidad de una tromboflebitis.

En infecciones estreptocócicas, la terapia debe durar un mínimo de 10 días, para poder eliminar así al microorganismo, de otro modo pueden ocurrir secuelas de la enfermedad estreptocócica (endocarditis o fiebre reumática). Deberían tomarse muestras para cultivo una vez finalizada la terapia para asegurarse la eliminación del microorganismo.

El uso prolongado de antibióticos puede resultar en el sobrecrecimiento desmedido de microorganismos no susceptibles. Es esencial la observación cuidadosa del paciente. Si ocurre sobreinfección bacteriana o fúngica durante la terapia debería discontinuarse el uso de la droga y tomarse medidas apropiadas. Cuando ocurren reacciones alérgicas, la penicilina debe ser retirada, a menos que según la opinión médica, la afección que está siendo tratada ponga en riesgo la vida del paciente y sólo sea tratable con penicilina. La Penicilina G sódica acusa por vía endovenosa en altas dosis (más de 10.000.000 de unidades) debe ser administrada lentamente dados los efectos adversos del desbalance electrolítico que produce el contenido en sodio de la penicilina.

Debe evaluarse el estado renal, cardíaco y vascular del paciente, y si se conoce o se sospecha la afección de alguna de las funciones, debe considerarse una disminución de la dosis. Se recomienda una evaluación frecuente del balance electrolítico, la función renal y hematopoyética durante la terapia, cuando se utilizan altas dosis de penicilina G acuosa de administración endovenosa.

Tests de laboratorio: Se recomienda en terapias prolongadas con penicilina, la evaluación periódica de la función renal, hepática y hematopoyética ante una posible alteración de la función orgánica. Esto es particularmente importante en neonatos, bebés y niños, y cuando se usan altas dosis.

Luego de dosis intravenosas grandes se han reportado falsos positivos en el test de Coomb.

Debe monitorearse el sodio sérico e implementarse medidas adecuadas si es necesario.

Al tratar infecciones gonocócicas en las cuales se sospecha de sífilis primaria o secundaria, deberían realizarse procedimientos adecuados de diagnóstico, incluyendo exámenes en campo oscuro y tests de laboratorio antes de administrar penicilina, y deberían realizarse tests serológicos mensuales por un mínimo de cuatro meses. Todos los casos de sífilis tratados con Penicilina deberían controlarse con exámenes clínicos y serológicos cada 6 meses durante 2 a 3 años.

En infecciones estafilocócicas sospechadas, deberían realizarse estudios de laboratorio adecuados, incluyendo un test de sensibilidad.

De existir función renal disminuida las dosis elevadas de penicilina pueden causar irritación meníngea y convulsiones.

CARCINOGENESIS, MUTAGENESIS Y ALTERACIÓN DE LA FERTILIDAD:

No hay información disponible de estudios a largo plazo sobre carcinogénesis, mutagénesis y alteración de la fertilidad, por el uso de penicilina.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS:

La administración concurrente de antibióticos bacteriostáticos (Eritromicina, Tetraciclinas) puede disminuir los efectos bactericidas de las penicilinas, al disminuir la velocidad de crecimiento bacteriano. Los agentes bactericidas actúan con mayor eficacia sobre la pared celular inmadura de

microorganismos en proliferación rápida. Esto ha sido demostrado *in vitro*, sin embargo, la significación clínica de esta interacción, no está bien documentada. Hay pocas situaciones clínicas para las cuales se indica el tratamiento conjunto con un antibiótico bacteriostático y uno bactericida. Sin embargo, en las circunstancias selectas en las que dicha terapia es apropiada, usando dosis adecuadas de agentes antibacterianos, y empezando primero la terapia con penicilina, se debería minimizar el potencial de la interacción.

Los niveles sanguíneos de penicilina pueden ser prolongados por administración conjunta de probenecid, dado que éste bloquea la secreción tubular renal de penicilinas. El desplazamiento de la penicilina de sus sitios de unión a proteínas plasmáticas conduce a un incremento en los niveles séricos.

EMBARAZO:

Categoría de embarazo: B. Efectos teratogénicos: Se han realizado estudios de reproducción en ratas, ratones y conejos que no han revelado la existencia de alteraciones de la fertilidad o de daños fetales debidos a la Penicilina G sódica. La experiencia humana con la penicilina durante el embarazo, no ha demostrado evidencia alguna de efectos adversos en el feto. Sin embargo, no existen estudios adecuados, bien controlados en mujeres embarazadas que demuestren concluyentemente que puede excluirse el efecto adverso de esta droga en el feto. La droga atraviesa la placenta. Dado que los estudios en animales no siempre son predictivos de la respuesta humana, esta droga sólo debería usarse en el embarazo cuando esto sea estrictamente necesario.

LACTANCIA:

Las penicilinas se excretan en leche materna. Deben ser administradas con precaución a madres que estén amamantando.

USO PEDIÁTRICO:

Las penicilinas son excretadas ampliamente sin alteraciones por el riñón. Dado que la función renal no está completamente desarrollada en bebés, la velocidad de eliminación será menor. Debe tenerse cuidado en la administración a recién nacidos y debe evaluarse la función orgánica frecuentemente.

REACCIONES ADVERSAS:

La penicilina es una sustancia de baja toxicidad, pero tiene un gran índice de sensibilización. Se han reportado las siguientes reacciones de hipersensibilidad: rash de piel que va desde erupciones maculopapulares hasta dermatitis exfoliativa, urticaria y reacciones que se asemejan a la enfermedad del suero, incluyendo escalofríos, fiebre, edema, artralgia y postración. Se han reportado casos de anafilaxia severos y a veces fatales. Se han reportado edema angioneurótico y nefritis intersticial. Raramente se observan eosinofilia, leucopenia, anemia hemolítica, neuropatía y nefropatía, siempre asociadas con altas dosis por vía endovenosa. Pacientes sometidos a una infusión endovenosa continua de penicilina G sódica en altas dosis (de 10 a 100 millones de unidades diarias) pueden sufrir hipernatremia particularmente en casos de insuficiencia renal. La irritación meníngea y las convulsiones pueden ser indicativas de este síndrome. Pueden ocurrir también arritmias cardíacas o paro cardíaco. Dosis altas de penicilina G sódica pueden generar insuficiencia cardíaca congestiva debida a la alta incorporación de sodio.

Los pacientes tratados por sífilis pueden sufrir reacción de Jarish-Herxheimer.

Existe hipersensibilidad cruzada con otros β-lactámicos.

CONDICIONES DE CONSERVACIÓN Y ALMACENAMIENTO:

Conservar en un lugar seco entre 8 °C y 30 °C, y al abrigo de la luz.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS

SOBREDOSIFICACIÓN:

Con el logro de altas concentraciones de penicilina en líquido cefalorraquídeo, pueden ocurrir reacciones adversas neurológicas incluso convulsiones. En caso de sobredosis debe discontinuarse la medicación, tratarse al paciente en forma sintomática y con una terapia de soporte. La Penicilina G sódica es hemodializable.

Ante la eventualidad de una sobredosificación u otra emergencia comunicarse con los siguientes centros:

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez. Tel. (011) 4962-6666 / 2247.

Hospital Posadas. Tel. (011) 4654-6648 / 4658-7777.

Centro Nacional de Intoxicaciones: 0800-333-0160

PRESENTACIONES:

Envases con un frasco ampolla y envases con 100 frascos ampolla, siendo este último para uso hospitalario exclusivo.

Especialidad Medicinal autorizada por el Ministerio de Salud.
Certificado N° 42.149

«ESTE MEDICAMENTO DEBE SER UTILIZADO EXCLUSIVAMENTE BAJO PRESCRIPCIÓN Y VIGILANCIA MÉDICA Y NO PUEDE REPETIRSE SIN NUEVA RECETA MÉDICA».

Director Técnico: Leonardo Iannello
Farmacéutico

Fecha última revisión: 08/1999



Planta: Lamadrid 802 - Quilmes - Pcia. de Bs. As., Argentina.
C.P. (B1878CZV) Tel. Fax: (54) (11) 4251-5954/5955