

UNIVERSIDAD DEL SURESTE

ALUMNA:

DULCE FLOR HERNANDEZ DIAZ

CATEDRÁTICA:

DRA. CLAUDIA GUADALUPE LÓPEZ FIGUEROA

MATERIA:

FARMACOLOGIA

PASIÓN POR EDUCAR

TRABAJO:

**CUADRO SINOPTICO: ANTIBIÓTICOS BETALACTÁMICOS Y
OTROS AGENTES ACTIVOS EN LA PARED CELULAR Y LA
MEMBRANA**

PICHUCALCO, CHIAPAS A 11 DE JULIO DEL 2020

ANTIBIÓTICOS BETALECTÁMICOS Y OTROS AGENTES ACTIVOS EN LA PARED CELULAR Y LA MEMBRANA

COMPUESTOS BETALECTÁMICOS

PENICILINAS

Comparten características de química, mecanismo de acción, farmacología y características inmunológicas

QUÍMICA

Todas las penicilinas tienen la estructura básica

Los sustituyentes del resto ácido 6-aminopenicilánico determinan las propiedades farmacológicas y antibacterianas esenciales de las moléculas resultantes.

1. Penicilinas

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

2. Penicilinas antiestafilocócicas

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.

3. Penicilinas de amplio espectro

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

B. Unidades y formulaciones de penicilina

Es la concentración inhibitoria mínima de cualquier penicilina generalmente se administra en mcg/mL

MECANISMO DE ACCIÓN

Inhiben el crecimiento bacteriano al interferir con la reacción de transpeptidación de la síntesis de la pared celular bacteriana.

RESISTENCIA

La resistencia a las penicilinas y otros betalactámicos se debe a uno de los cuatro mecanismos generales:

- 1) inactivación de antibiótico por betalactamasa
- 2) Modificación de PBP blanco,
- 3) Penetración alterada del fármaco a PBP blanco
- 4) flujo de salida de antibióticos

FARMACOCINÉTICA

La absorción del fármaco administrado por vía oral difiere en gran medida para las penicilinas individuales, dependiendo en parte de su estabilidad ácida y unión a proteínas.

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.

A. Penicilina

La penicilina G es un fármaco de elección para las infecciones causadas por estreptococos, meningococos, algunos enterococos, neumococos susceptibles a la penicilina, estafilococos que no producen betalactamasas

B. Penicilinas resistentes a la betalactamasa estafilocócica

Estas penicilinas semisintéticas están indicadas para las infecciones causadas por estafilococos productores de betalactamasa, aunque las cepas de estreptococos y neumococos susceptibles a la penicilina también son susceptibles a estos agentes.

C. Penicilinas de amplio espectro

Tienen una actividad mayor que la penicilina frente a las bacterias gramnegativas debido a su capacidad mejorada para penetrar en la membrana externa gramnegativa.

ANTIBIÓTICOS BETALACTÁMICOS Y OTROS AGENTES ACTIVOS EN LA PARED CELULAR Y LA MEMBRANA

CEFALOSPORINAS Y CEFAMICINAS

Las cefalosporinas son similares a las penicilinas, pero son más estables a muchas betalactamasas bacterianas y, por tanto, tienen un espectro de actividad más amplio.

QUÍMICA — El núcleo de las cefalosporinas, el ácido 7-aminocefalosporánico

CEFALOSPORINAS DE PRIMERA GENERACIÓN

Las cefalosporinas de primera generación incluyen cefazolina, cefadroxilo, cefalexina, cefalotina, cefapirina y cefradina;

A. Oral

Después de dosis orales de 500 mg, los niveles séricos máximos son 15-20 mcg/mL. La concentración urinaria suele ser muy alta, pero en la mayoría de los tejidos los niveles son variables y generalmente más bajos que en el suero.

B. 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.

USOS CLÍNICOS

Los medicamentos orales se pueden usar para el tratamiento de las infecciones del tracto urinario y las infecciones por estafilococos o estreptococos, incluidas la celulitis o el absceso de tejidos blandos.

CEFALOSPORINAS DE SEGUNDA GENERACIÓN

Los miembros de las cefalosporinas de segunda generación incluyen el cefaclor, el cefamandol, la cefonicida, la cefuroxima, el cefprozil, el loracarbef y la ceforanida.

A. 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.

B. 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.

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.

CEFALOSPORINAS DE TERCERA GENERACIÓN

Los agentes de tercera generación incluyen cefoperazona, cefotaxima, ceftazidima, ceftizoxima, ceftriaxona, cefixima, cefpodoxima proxetilo, cefdinir, cefditoren pivoxilo, ceftibutén y moxalactama.

ACTIVIDAD ANTIMICROBIANA

Pueden ser activos contra *Citrobacter*, *S. marcescens* y *Providencia*. También son efectivos contra las cepas productoras de betalactamasa de *Haemophilus* y *Neisseria*.

FARMACOCINÉTICA Y DOSIFICACIÓN

La infusión intravenosa de 1 g de una cefalosporina parenteral produce niveles séricos de 60-140 mcg/mL.

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.

ANTIBIÓTICOS BETALACTÁMICOS Y OTROS AGENTES ACTIVOS EN LA PARED CELULAR Y LA MEMBRANA

CEFALOSPORINAS Y CEFAMICINAS

CEFALOSPORINAS DE CUARTA GENERACIÓN

Es más resistente a la hidrólisis por las betalactamasas cromosómicas

CEFALOSPORINAS ACTIVAS CONTRA ESTAFILOCOCOS RESISTENTES A LA METICILINA

Los antibióticos betalactámicos con actividad contra los estafilococos resistentes a la meticilina se encuentran actualmente en desarrollo.

CEFALOSPORINAS COMBINADAS CON INHIBIDORES DE LA BETALACTAMASA

Se han desarrollado nuevas combinaciones de cefalosporina con inhibidores de betalactamasa para combatir las infecciones gramnegativas resistentes

EFFECTOS ADVERSOS DE CEFALOSPORINAS

A. Alergia

Pueden desencadenar una variedad de reacciones de hipersensibilidad, que incluyen anafilaxis, fiebre, erupciones cutáneas, nefritis, granulocitopenia y anemia hemolítica

B. Toxicidad

- La irritación local puede producir dolor después de la inyección intramuscular y tromboflebitis después de la inyección intravenosa.
- La toxicidad renal, incluida la nefritis intersticial y la necrosis tubular, puede ocurrir de manera poco frecuente.

OTROS MEDICAMENTOS BETALACTÁMICOS

MONOBACTAMS

Su espectro de actividad se limita a organismos aeróbicos gramnegativos (incluyendo *P. aeruginosa*).

INHIBIDORES DE BETALACTAMASA (ÁCIDO CLAVULÁNICO, SULBACTAM, TAZOBACTAM Y AVIBACTAM)

Los inhibidores tradicionales de betalactamasa (ácido clavulánico, sulbactam y tazobactam) se parecen a las moléculas de betalactama pero tienen una acción antibacteriana muy débil.

CARBAPENEMS

Los carbapenémicos están estructuralmente relacionados con otros antibióticos betalactámicos. Es resistente a la mayoría de las betalactamasas, pero no a las carbapenemasas ni a las metalobetalactamasas.

ANTIBIÓTICOS BETALACTÁMICOS Y OTROS AGENTES ACTIVOS EN LA PARED CELULAR Y LA MEMBRANA

ANTIBIÓTICOS GLUCOPÉPTIDOS

VANCOMICINA

La vancomicina es un antibiótico aislado de la bacteria ahora conocida como *Amycolatopsis orientalis*. Es activo principalmente contra bacterias grampositivas debido a su gran peso molecular y la falta de penetración a través de las membranas celulares gramnegativas.

Mecanismos de acción y bases de resistencia

La vancomicina es bactericida para las bacterias grampositivas en concentraciones de 0.5-10 mcg/mL.

Farmacocinética

La vancomicina se absorbe poco en el tracto intestinal y se administra por vía oral sólo para el tratamiento de la colitis causada por *C. difficile*.

Usos clínicos

Las indicaciones importantes para la vancomicina parenteral son las infecciones del torrente sanguíneo y la endocarditis causada por estafilococos resistentes a la meticilina.

Reacciones adversas

Las reacciones adversas con la administración parenteral de vancomicina se encuentran con bastante frecuencia. La mayoría de las reacciones son relativamente menores y reversibles.

OTROS AGENTES ACTIVOS EN LA MEMBRANA O LA PARED CELULAR BETALACTÁMICOS

DAPTOMICINA

- La daptomicina es un nuevo producto de fermentación de lipopéptido cíclico de *Streptomyces roseosporus*.
- Su espectro de actividad es similar al de la vancomicina, excepto que puede ser activo contra cepas de enterococos resistentes a la vancomicina y S.

FOSFOMICINA

La fosfomicina trometamol, una sal estable de fosfomicina (fosfomicina), inhibe una etapa muy temprana de la síntesis de la pared celular bacteriana.

BACITRACINA

- La bacitracina es una mezcla de péptidos cíclicos obtenida por primera vez de la cepa Tracy de *Bacillus subtilis* en 1943.
- Es activa contra microorganismos grampositivos

CICLOSERINA

- La cicloserina es un antibiótico producido por *Streptomyces orchidaceous*.
- Es soluble en agua y muy inestable a pH ácido.
- La cicloserina inhibe muchos organismos grampositivos y gramnegativos, pero se usa casi exclusivamente para tratar la tuberculosis causada por cepas de *Mycobacterium tuberculosis* resistentes a los agentes de primera línea.