



**Universidad del
sureste**



FARMACOLOGIA Y VETERINARIA I

Antibióticos

Gómez Espinosa Nadia Arely

3° Cuatrimestre

DIAZ SOLIS OSCAR FABIAN

Tuxtla Gutiérrez, Chiapas

01-08 -2020

M.V.Z.

Familia

Antibióticos

▶ Aminoglucósidos

• MODO DE ACCIÓN

Se une a los ribosomas bacterianos (fracción 30S) lo que ocasiona la producción de proteínas bacterianas defectuosas, o bien la inhibición total de la síntesis de proteínas de la bacteria.

• Estructura Química

Son compuestos policationicos que contienen un aminocitol con aminoazúcares cíclicos ligados por enlaces glicosídicos. Generalmente se usan las sales de Sulfato.

• Toxicidad

Ototoxicidad y nefrototoxicidad de dosis-dependientes. Dosis altas espaciadas son menos tóxicas que dosis bajas repetidas, sin menos casos de la acción antimicrobiana.

• Farmacocinética

No se absorben vía oral. Penetran poco en el LCR. Se excretan en la orina por filtración glomerular.

FAMILIA ANTIBIOTICOS VIA ADMINIS

Estreptomicina	Estreptomicina	IM
Neomicina	Neomicina	VO
	Amikacina	IM, IV, IV
Kanamicina	Kanamicina	
	Tobramicina	IM, IV
	Gentamicina	
Gentamicina	Netilmicina	IM, IV, IM, IM
	Sisomicina	
Espectinomina	Espectinomina	IM

▶ Betalactamicos

- Penicilinas
- Cefalosporinas
- Monobactamas
- Carbapenemes
- Inhibidores de Betalactamicos

• MODO DE ACCIÓN (GENERAL)

Son antibioticos bactericidas que actúan inhibiendo la síntesis de la pared celular bacteriana. Inhiben la transpeptidación en las etapas finales de la síntesis del peptidoglicano, polímero esencial para la pared bacteriana. La alteración de la pared produce la activación de enzimas autolíticas que provocan la destrucción de la bacteria.

• Estructura Química

Presentan un anillo central llamado betalactámico que da nombre al grupo.

→ PENICILINAS ←

• Estructura Química

Poseen un anillo betalactámico asociado a un anillo tiazolidínico, lo que forma el núcleo responsable de su actividad biológica, el ácido 6-amino-penicilánico.

• Toxicidad

Tiene capacidad de producir alergias en un 5% de la población al combinarse la estructura betalactámica con proteínas orgánicas, que actúan como haptenos inductores en la formación de anticuerpos.

• Farmaco-Cinética

Dependiendo la cadena lateral añadida al núcleo de las penicilinas varían ampliamente sus propiedades farmacocinéticas. La penicilina G se absorbe un 30% por vía oral y destruida por el pH del estómago.

• Espectro Antibacteriano

Son efectivos frente a gérmenes gram positivos en general, y las penicilinas de amplio espectro también lo son frente a gram negativos.

• Resistencias

La base principal es la producción de penicilinasas, una betalactamasa que rompe el anillo betalactámico.

Espectro

Penicilinas

Via de Adminis

	Becl penicilina	
Activas frente a Gram positivo	Bencilpenicilina (penicilina G) fenoximetilpenicilina (penicilina V)	IV VO
	Carboxipenicilinas	
Gram Negativo	Ticarcilina	IM, IV
	Aminopenicilina	
Amplio Espectro	Amoxicilina	VO
	Ampicilina	VO, IM, IV
	Bacampicilina	VO
	Ura dopenicilinas	
Amplio Espectro	piperacilina	IV

Cefalosporinas

• Estructura Química

Son antibióticos derivados de la cefalosporina C (antibiótico natural). El núcleo del antibiótico es el ácido 7-amino-cefalosporino que por modificación de sus cadenas laterales ha dado lugar a numerosos derivados.

• Toxicidad

Tienen un margen terapéutico amplio y las reacciones adversas son similares a las penicilinas.

• Generaciones.

1º Generación (Gef-1ºG) :-

- La más activa frente a cocos gram positivos
- Actividad aceptable frente a *E. coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *P. mirabilis*

→ Orales

Cefadroxilo, Cefalexina, Cefradina

→ Parentales

Cefalotina, cefazolina.

2º Generación (Gef-2ºG) :-

- Igual de activas que las Gef-1ºG frente a cocos gram positivos
- Más activas frente a enterobacilos gram negativos
- También activas frente a *H. influenzae*, *M. catarrhalis* y *S. pneumoniae* (con sensibilidad reducida a penicilinas).

→ Orales

Cefaclor, Cefuroxima axetilo, Cefprozolo

→ Parentales

Cefuroxima, Cefonicida, Cefoxitina, Cefminox

3º Generación (Gef-3ºG) :-

- Menos activas frente a cocos gram positivos
- Mayor actividad frente a enterobacilos gram negativos. *H. influenzae* y *N. gonorrhoeae*
- Ceftriaxima activa frente a *P. aeruginosa*

→ Orales

Cefixima, Cefpodoxima proxetilo, Ceftibuteno, Cefdinor

→ Parentales

Cefatoxima, Ceftriaxima, Ceftriaxona

4^o Generación (Cef-4G)

- Más activas que las Cef-3^oG frente a gram positivos y enterobacterias gram negativas
- Igual actividad que ceftazidima frente a *P. aeruginosa*

• Parentales

Cefepima

Cefpirora

→ MONOBACTAMAS ←

Estructura Química

Tiene un anillo betalactámico monocíclico, es decir, los dos anillos se han reducido a solo uno.

• Toxicidad

Reacciones adversas comunes con otros betalactámicos, pero carece de hipersensibilidad cruzada con ellos.

• Farmaco Cinética

Se administra vía parenteral

• Resistencias

Tienen una elevada resistencia a la inhibición por betalactámicos, no presentan resistencia cruzada con otros betalactámicos.

• Espectro Antibacteriano

Germenes gram negativos aerobios. Buena efectividad frente a *Pseudomonas aeruginosa*. No son efectivos con gram positivos y anaerobios.

→ CARBAPENEMES

• Estructura Química

El azufre endocíclico del anillo betalactámico está sustituido por un grupo metileno.

• Toxicidad

Impenem puede producir alteraciones neurológicas.

• Farmacocinética

Administración por vía IV.

• Espectro bacteriano

Muy amplio, poseen el espectro de acción mayor que se conoce incluyendo gram positivos y gram negativos así como gérmenes anaerobios; buena actividad frente a *Pseudomonas aeruginosa* y *Bacteroides fragilis*.

• Resistentes

Son frecuentes con *Pseudomonas aeruginosa*, y además son potentes inductores de betalactámicos por lo que aun que a los carbapenems no les afecte, pueden inducir resistencia a otros betalactámicos.

→ INHIBIDORES DE BETA LACTAMAS

• Estructura Química

Son análogos estructurales de las penicilinas, conservan el anillo betalactámico.

• Toxicidad

Las reacciones adversas son en general leves. Las más frecuentes son diarrea, náuseas, vómito, exantemas cutáneos y elevación transitoria de transaminasas.

• Farmacocinética

- Amoxicilina con ácido clavulánico VO/IV
- Amoxicilina con sulbactam VO/IM
- Piperacilina con tozobactam IV/IM

• Espectro Antibacteriano

Su espectro incluye organismos que inicialmente eran susceptibles a los betalactámicos y que han dejado de serlo por difusión de cepas productoras de penicilinas.

• Resistencias

Son capaces de inhibir los betalactámicos tipo II a V pero no los de tipo I, producidas por *Serratia*, *Enterobacter*, *Citrobacter* y algunas cepas de *Pseudomonas aeruginosa*.

▶ **Antifolatos** * Clorafenicol *

• MODO DE ACCIÓN

Interfieren con la síntesis proteica bacteriana y son bacteriostáticos.

• Estructura Química

Es un derivado del ácido dicloroacético y contiene un anillo pirroliceno. Hay otros componentes

de este grupo, que son derivados químicos del cloranfenicol

• Toxicidad

Debilidad de la médula ósea causada por eritropoietina, a veces grave. Síndrome gris del recién nacido, con alta mortalidad

• Farmacocinética

Es activo por vía oral (en forma de polivit), y se difunde al LCR aunque las meninges no estén inflamadas. Se metaboliza en el hígado

• Espectro Antibacteriano

El cloranfenicol fue el primer antibacteriano de amplio espectro de descubrimiento. Es efectivo frente a gérmenes gram positivos y gram negativos, así como frente a rickettsias y clamideas

• Resistencias

son frecuentes y se deben a la presencia de una acetiltransferasa específica que inactiva la droga.

▶ Glucopéptidos

- Vancomicina
- Teicoplanina

• MODO DE ACCIÓN

Actúa a través de la inhibición de la síntesis de la pared bacteriana.

- **Toxicidad**
ototoxicidad y nefrotoxicidad

- **Farmacocinetica**
Son Farmacos para uso via parenteral

- **Especro Antivacteriano**
Muy activos frente a cocos gram positivos.
La vancomicina se utiliza para las afec-
ciones por estafilococos meticilin-resistente
y para el tratamiento y profilaxis de la
endocarditis cuando otros antibioticos no
pueden usarse debido a hipersensibilidad

▶ **Lincosamidas**

- Clindamicina
- Lincomicina

• **MODO DE ACCIÓN**

Se unen a la fracción S05 de los ribosomas bacterianos interrumpiendo la síntesis proteica, de forma similar a los macrolidos

• **Estructura Química**

La lincomicina es un derivado del ácido propihidrico y la clindamicina de su derivado 7-desoxi 7-cloro.

• **Toxicidad**

Su principal riesgo es el de poder producir colitis pseudomembranosa.

• Farmacocinética

Activas por vía oral y Parental

• Espectro Antivacteriano

Aunque no se relacionan estructuralmente, las lincosamidas tienen un espectro de acción muy similar a los macrolidos. Principalmente activos frente a gram positivos y frente a Bacteroides spp

• Resistencia

Pueden aparecer resistencias cruzadas entre lincosamidas, macrolidos y estreptograminas

▶ Macrolidos

MODO DE ACCIÓN

Inhiben la síntesis proteica bacteriana por fijación a la subunidad 50S de los ribosomas. Pueden ser bacteriostáticos o bactericidas

• Estructura Química

Estos compuestos por un anillo lactónico macrocíclico que puede tener 14, 15 o 16 átomos de carbono, al que se unen diversos azúcares.

• Toxicidad

En general presentan buena tolerancia, siendo los efectos adversos más frecuentes relacionados con el aparato digestivo, náuseas y vómitos.

FARMACO

Via Administracion

Azitromicina	VO, IV
Clarithromicina	VO, IV
Doxitromicina	VO
Eritromicina	VO, IV
Espiramicina	VO
Josamicina	VO
Midecamicina	VO
Roxitromicina	VO
Telitromicina	VO

► QUINOLAS

- De primera generacion:
 - Acido nalidixico
- Fluoroquinolonas
 - Ciprofloxacino
 - Ofloxacino
 - Levofloxacino
 - Moxifloxacino
 - Norfloxacino

MODO DE ACCIÓN

Son agentes bactericidas que actúan inhibiendo selectivamente la ADN-girasa bacteriana, enzima que interviene en el plegamiento de la doble hélice del ADN

• Estructura Química

Son antibacterianos sintéticos con una estructura química básica común, compuesto por dos anillos

Norma

• Toxicidad

En general son bien tolerados, con reacciones adversas leves y poco frecuentes que pueden afectar el aparato digestivo, sistema nervioso central y fototoxicidad.

• Farmacocinética

Todo son efectivos vía oral.

• Espectro Antibacteriano

Ácido nalidixico es efectivo frente a gram negativo y muy poco efectivo frente a Pseudomonas sp. y gram positivos.

▶ Sulfamidas

MODO DE ACCIÓN

Son generalmente bacterios estáticos y actúan inhibiendo la síntesis del ácido fólico de los organismos susceptibles.

• Estructura Química

son análogos del ácido paraaminobenzóico

• Farmacocinética

Se clasifican según su tasa de excreción en sulfamidas de acción corta, intermedia, larga o ultralarga, algunos no se absorben vía oral.

• Espectro Antibacteriano

Su amplio espectro ha disminuido por la aparición de resistencias.