

Nombre del alumno:

Paola Berenice Ortiz Garcia

Nombre del profesor:

Lic. Ervin Silvestre Castillo

Licenciatura:

Enfermería

Materia:

Farmacología

Nombre del trabajo: Cuadro Sinóptico

Cuadro del tema:

“Antibióticos Macrolidos y Quinolonas”

ANTIBIOTICOS MACROLIDOS

CLASIFICACIÓN

Esta familia está formada por compuestos con un anillo de 14, 15 o 16 átomos de carbono se unen mediante enlaces glucosídicos.

Se clasifican en: a) Macrolidos de 14 anillos, b) Macrolidos de 15 anillos, y c) Macrolidos de 16 anillos.

Los Macrolidos de 14 átomos de carbono son más estables en medio del ácido, tienen mayor biodisponibilidad oral.

La azitromicina es el único Macrolido de 15 átomos de carbono. Los Macrolidos de 16 átomos de carbono alcanzan los más elevados porcentajes de estabilidad en medio ácido

MECANISMO DE ACCION

Los Macrolidos actúan inhibiendo la síntesis de proteínas dependiente del ARN de la bacteria, se unen a subunidades ribosomiales 50S de microorganismos sensibles

Presentan una actividad bacteriostática o bactericida según el microorganismo, la fase del crecimiento y concentración alcanzada por el fármaco en el tejido diana

Los Macrolidos se caracterizan por requerir 2-4 veces la concentración mínima inhibitoria para seguir la concentración mínima bactericida.

La concentración debe mantenerse durante el tiempo suficiente, ya que el efecto bactericida depende del tiempo

ACCIONES FARMACOLOGICAS

Poseen en general una potente actividad antibacteriana sobre la mayor parte de cocos Grampositivos, muchas bacterias anaerobias, fundamentalmente las que constituyen la flora de la boca

Los bacilos gramnegativos son intrínsecamente resistentes a los Macrolidos debido a la impermeabilidad de su membrana.

La gran sensibilidad de los estreptococos a este grupo de antibióticos justifica su utilización como fármaco de primera elección en infecciones por estas bacterias en pacientes alérgicos a los betalactámicos.

Hay que tener en cuenta que los neumococos resistentes a penicilina, tanto los moderadamente resistentes como los que presentan un alto grado de resistencia.

Actividad frente a otros patógenos menos habituales

Los Macrolidos no son agentes con actividad antimicobacteriana. La claritromicina y la azitromicina ejercen efectos sinérgicos asociados a fármacos, en las infecciones por Mycobacterium avium complex.

Roxitromicina, claritromicina y azitromicina inhiben el crecimiento intracelular de *Toxoplasma gondii*.

Muestran sensibilidad frente a *Cryptosporidium*. Y la azitromicina amplía su espectro de actividad frente a gramnegativos

La eficacia de la azitromicina es superior al resto de los Macrolidos en las infecciones por bacterias de crecimiento intracelular.

MECANISMO DE RESISTENCIA

La resistencia puede producirse por una baja permeabilidad, aparición de cambios estructurales de lugar de unión del Macrolido al ribosoma.

Algunas cepas de neumococo y *S. pyogenes* presentan una proteína de membrana que expulsan a Macrolidos de 14 y 15 átomos, pero no a los de 16

Las cepas de *Staphylococcus* presentan una bomba de expulsión activa sobre los Macrolidos.

En las enterobacterias se han detectado enzimas que hidrolizan el anillo lactona de los Macrolidos

FARMACOCINETICA

Los Macrolidos se distribuyen en los tejidos y se fijan entre un 60 y 90% de las proteínas plasmáticas, fundamentalmente el alfa-2-globulina

La entrada de los Macrolidos en el interior de las células, se produce por difusión pasiva, haciendo más veloz su forma no ionizada.

Algunos Macrolidos pueden inhibir la actividad enzimática CYP3A4, esto se traduce como el incremento de niveles plasmáticos de aquellos fármacos que son sustratos de esa enzima

Para administrar dosis en los Macrolidos en pacientes con alteración leve de insuficiencia renal no se necesita que se ajuste.

EFFECTOS

ADVERSOS

Los Macrolidos son fármacos que el paciente puede tolerar. Los efectos adversos de eritromicina son: las alteraciones gastrointestinales.

Se puede generar un efecto estimulante del fármaco sobre la motilidad gastrointestinal, esto sucede con todos los Macrolidos, en el anillo de 14 átomos este efecto parece mayor

Cuando se eleva la administración de eritromicina en pacientes ancianos o con insuficiencia renal puede provocar sordera.

La claritromicina puede producir un ligero aumento de las transaminasas, lo puede aumentar en un 5%

INTERACCIONES

FARMACOLOGICA

Los Macrolidos pueden producir interacciones con otros fármacos por reducir su metabolismo hepático en el sistema del citocromo P-450, aumentando su concentración

Cuando se administra eritromicina puede producir un mayor efecto ya que se administra a dosis más elevadas, la capacidad potencial es variable para los diferentes grupos de Macrolidos.

APLICACIONES

TERAPEUTICAS

Las indicaciones son superponibles a todos los Macrolidos

En las indicaciones figura el tratamiento de infecciones de vías respiratorias superiores, inferiores y área de otorrinolaringología

Infecciones de piel y tejidos blandos, acné, infecciones genitales no gonocócicas, gastroenteritis, ocasionadas por *Campylobacter jejunii*, úlcera gástrica y duodenal

TELITROMICINA

Pertenece al grupo de los cetolidos, se emparentan con la familia de los Macrolidos. Su estructura química se deriva de los Macrolidos de 14 átomos.

La telitromicina se absorbe de manera rápida tras su administración oral, se metaboliza a nivel hepático, su eliminación renal es inferior al 10%

Presentan menos interacciones que los Macrolidos y su perfil de efectos adversos es similar al de los Macrolidos.

Se administra por vía oral a dosis de 800 mg/24h. No es necesario ajustar la dosis en pacientes adultos y su uso en niños no es contraindicado.

ANTIBIOTICOS
QUINOLONAS

ESTRUCTURA QUÍMICA

Está formada por dos anillos, con un nitrógeno en posición 1, un grupo carbonilo en posición 4 y un grupo carboxilo en la posición 3

Cuando se lleva un átomo de flúor en la posición 6 la potencia y el espectro aumentan

Por este motivo se ha desarrollado una nueva sustancia en la que se ha retirado el átomo de flúor de la posición 6, garenoxacino.

CLASIFICACION

Al igual que las cefalosporinas, se clasifican en cuatro generaciones

Guardan relación con un espectro similar entre las quinolonas pertenecientes a un mismo grupo

MECANISMO DE ACCION

Producen una inhibición directa en la síntesis del ADN bacteriano, mediante una interacción del fármaco con complejos formados por el ADN

La topoisomerasa IV. La inhibición de la ADN-girasa se traduce en alteraciones del «superenrollamiento» y, en el caso de la topoisomerasa IV en la inhibición de las hebras de ADN-hijo

La actividad de las quinolonas en las bacterias gramnegativas se centra en el bloqueo de la ADN-girasa, mientras que en las bacterias grampositivas acontece sobre la topoisomerasa IV.

RESISTENCIA

Hay dos mecanismos de resistencia: a) la disminución de las concentraciones intrabacterianas del fármaco, mediado por una alteración en la Porinas o la existencia de bombas de expulsión

Y b) la alteración de las dianas de las quinolonas por mutación en los genes que codifican la ADN-girasa y la topoisomerasa IV.

Se ha encontrado una relación inversa entre la concentración de la quinolona y la selección de mutantes resistentes

FARMACOCINETICA

Absorción: Todas las quinolonas presentan una buena y rápida absorción por vía oral, que es dificultada por los alimentos.

Distribución: Todas las quinolonas se unen a proteínas plasmáticas en un bajo porcentaje, inferior al 50% y se distribuyen ampliamente por tejidos y fluidos corporales

Eliminación: Su eliminación se produce fundamentalmente por vía renal por secreción tubular y filtración glomerular

EFFECTOS ADVEROSOS

Las quinolonas son bien toleradas; sin embargo, pueden producir con frecuencia efectos indeseables leves y reversibles.

Tiene otros efectos adversos como alteraciones digestivas, alteraciones del sistema nervioso central y alteraciones articulares