



Nombre de alumnos: Lizbeth De Coss Ruiz
Nombre del profesor: Claudia Guadalupe Figueroa López

Materia: Farmacología

Grado: 3er cuatrimestre

Grupo: A

Comitán de Domínguez Chiapas a Julio de 2020.

Antibióticos betalactámicos y otros agentes activos en la pared celular y la membrana.

Penicilina:

Química: Todas las penicilinas tienen la estructura básica. Un anillo de tiazolidina (A) está unido a un anillo de betalactama (B) que porta un grupo amino secundario (RNH-).

Clasificación: Las penicilinas se asignan a uno de tres grupos. Dentro de cada uno de éstos hay compuestos que son relativamente estables al ácido gástrico y adecuado para la administración oral.

Penicilinas (p. ej., penicilina G): Estas tienen una actividad máxima frente a organismos grampositivos, cocos gramnegativos y anaerobios que no producen betalactamasas. Tienen poca actividad contra los bacilos gramnegativos, y son susceptibles a la hidrólisis por las betalactamasas.
Penicilinas antiestafilocócicas (p. ej., nafcilina): Son activos contra los estafilococos y los estreptococos, pero no contra los enterococos, las bacterias anaerobias y los cocos y bacilos gramnegativos.
Penicilinas de amplio espectro (aminopenicilinas y penicilinas antipseudomonas): Estos fármacos retienen el espectro antibacteriano de la penicilina y tienen actividad mejorada contra los bacilos gramnegativos.

Mecanismo de acción: como todos los antibióticos betalactámicos, inhiben el crecimiento bacteriano al interferir con la reacción de transpeptidación de la síntesis de la pared celular bacteriana. Destruyen las células bacterianas sólo cuando están creciendo activamente y sintetizan la pared celular.

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: PBP blanco alteradas son la base de la resistencia a la metilina en los estafilococos y de la resistencia a la penicilina en los neumococos y los enterococos más resistentes.
- 4) flujo de salida de antibióticos. La producción de betalactamasa es el mecanismo más común de resistencia.

Usos clínicos: nunca deben usarse para infecciones virales. Deben prescribirse solo cuando existe una sospecha de una infección documentada con, organismos susceptibles.

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, *Treponema pallidum* y algunas otras espiroquetas. Algunas especies de *Clostridium*, *Actinomyces* y algunos otros bacilos grampositivos y organismos gramnegativos anaerobios no productores de betalactamasa.
B. Penicilinas resistentes a la betalactamasa estafilocócica (metilina, nafcilina e isoxazolil penicilinas): semisintéticas están indicadas para las infecciones causadas por estafilococos productores de betalactamasa.
C. Penicilinas de amplio espectro (aminopenicilinas, carboxipenicilinas y ureidopenicilinas): La amoxicilina se administra por vía oral para tratar la sinusitis bacteriana, la otitis y las infecciones del tracto respiratorio inferior. La ampicilina y la amoxicilina son los antibióticos betalactámicos orales más activos contra los neumococos con MIC elevadas a la penicilina y son los antibióticos betalactámicos preferidos para tratar las infecciones que se sospecha son causadas por estas cepas. La ampicilina es útil para tratar infecciones graves causadas por organismos susceptibles, incluidos anaerobios, enterococos, *L. monocytogenes* y cepas betalactamasas negativas de cocos gramnegativos y bacilos como *E. coli*, y *Salmonella* sp.

Reacciones adversas: La mayoría de los efectos adversos graves se deben a la hipersensibilidad. Reacción alérgica

CEFALOSPORINAS Y CEFAMICINAS

Química: La actividad antimicrobiana intrínseca de las cefalosporinas Naturales es baja, pero la unión de varios grupos R1 y R2 ha producido cientos de compuestos potentes, muchos de ellos con baja toxicidad.

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.

Clasificación: clasificado tradicionalmente en cuatro grandes grupos o generaciones.

CEFALOSPORINAS DE PRIMERA GENERACIÓN: incluyen cefazolina, cefadroxilo, cefalexina, cefalotina, cefapirina y cefradina; Estos Medicamentos son muy activos contra los cocos grampositivos, como los estreptococos y los estafilococos.

Farmacocinética y dosificación:

Oral: La cefalexina se administra típicamente en dosis orales.
Parietal: La cefazolin también se puede administrar por vía intramuscular.
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. La cefazolina no penetra el sistema nervioso central y no puede usarse para tratar la meningitis.

CEFALOSPORINAS DE SEGUNDA GENERACIÓN: el cefaclor, el cefamandol, la cefonicida, la cefuroxima, el cefprozil, el loracarbef y la ceforanida. La cefuroxima y el cefaclor son activos contra *H. influenzae*. La cefoxitina y el cefotetan son activos contra *B. fragilis* y algunas cepas de *Serratia*.

Farmacocinética y dosificación:

Oral: La cefuroxima axetil es la cefalosporina oral más comúnmente utilizada.
Dosis: 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.
Parental: Las dosis y los intervalos de dosificación varían según el agente específico.
Usos clínicos: 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: cefoperazona, cefotaxima, ceftazidima, ceftizoxima, ceftriaxona, cefixima, cefpodoxima proxetilo, cefdinir, cefditoren pivoxilo, cefibuten y moxalactama.

Actividad antimicrobiana: estos medicamentos han expandido la cobertura gramnegativa, y algunos son capaces de cruzar la barrera hematoencefálica. activos contra *Citrobacter*, *S. marcescens* y *Providencia*. También son efectivos contra las cepas productoras de betalactamasa de *Haemophilus* y *Neisseria*. La ceftazidima es el único agente con actividad útil contra *P. aeruginosa*.

Farmacocinética y dosificación:

Las cefalosporinas de tercera generación penetran bien los fluidos corporales y los tejidos, y las cefalosporinas intravenosas alcanzan niveles en el líquido cefalorraquídeo suficientes para inhibir la mayoría de los patógenos susceptibles. la ceftriaxona (semivida de 7-8 horas) se puede inyectar una vez cada 24 horas a una dosis de 15-50 mg/ kg/d. Una sola dosis diaria de 1 g es suficiente para la mayoría de las infecciones graves, con 2 g cada 12 horas recomendadas para el tratamiento de la meningitis y 2 g cada 24 horas recomendadas para la endocarditis.
Usos clínicos: infecciones por *Enterobacter*, La ceftriaxona y la cefotaxima están aprobadas para el tratamiento de la meningitis, incluida la meningitis causada por neumococos, meningococos, *H. influenzae* y bacilos gramnegativos entéricos susceptibles.

CEFALOSPORINAS DE CUARTA GENERACIÓN: La cefepima es la única cefalosporina de cuarta generación disponible.
Es más resistente a la hidrólisis por las betalactamasas cromosómicas (p. ej., las producidas por *Enterobacter*). Tiene una buena actividad contra *P. aeruginosa*, Enterobacteriaceae, *S. aureus* sensible a la meticilina y *S. pneumoniae*.

EFFECTOS ADVERSOS DE CEFALOSPORINAS:

- Alergia:** pueden desencadenar una variedad de reacciones de hipersensibilidad, que incluyen anafilaxis, fiebre, erupciones cutáneas, nefritis, granulocitopenia y anemia hemolítica.
- Toxicidad:** 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*). no tienen actividad contra bacterias grampositivas o anaerobios.
INHIBIDORES DE BETALACTAMASA (ÁCIDO CLAVULÁNICO, SULBACTAM, TAZOBACTAM Y AVIBACTAM): tienen una acción antibacteriana muy débil. El doripenem, el ertapenem, el imipenem y el meropenem
CARBAPENEMS: están estructuralmente relacionados con otros antibióticos betalactámicos. El doripenem y el meropenem son similares al imipenem pero tienen una actividad ligeramente mayor contra los aerobios gramnegativos y una actividad ligeramente menor contra los grampositivos. Los carbapenémicos son muy activos en el tratamiento de las infecciones por *Enterobacter*.

Antibióticos glucopéptidos

VANCOMICINA: Es activo principalmente contra bacterias grampositivas debido a su gran peso molecular y la falta de penetración a través de las membranas celulares gramnegativas. El producto intravenoso es soluble en agua y estable durante 14 días en el refrigerador después de la reconstitución. La resistencia a la vancomicina en los enterococos se debe a la modificación del sitio de unión de D-Ala-D-Ala del bloque de construcción de peptidoglucano en el que el D-Ala terminal se reemplaza por D-lactato.
TEICOPLANINA: puede administrarse por vía intramuscular o intravenosa. La teicoplanina tiene una semivida larga (45-70 horas), lo que permite una dosificación una vez al día.
TELAVANCINA: El medicamento está aprobado para el tratamiento de infecciones complicadas de la piel y los tejidos blandos y la neumonía adquirida en el hospital a una dosis de 10 mg/kg IV por día.
DAPTOMICINA: La daptomicina es un nuevo producto de fermentación de lipopeptido 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. aureus*.
FOSFOMICINA: La fosfomicina trometamol, una sal estable de fosfomicina (fosfomicina), inhibe una etapa muy temprana de la síntesis de la pared celular bacteriana.
BACITRACINA: No existe resistencia cruzada entre la bacitracina y otros fármacos antimicrobianos.
La bacitracina es muy nefrotóxica cuando se administra sistémicamente y solo se usa de manera tópica
CICLOSERINA: La cicloserina inhibe muchos organismos grampositivos y gramnegativos, pero se usa casi exclusivamente para tratar la tuberculosis causada