



LICENCIATURA EN MEDICINA HUMANA

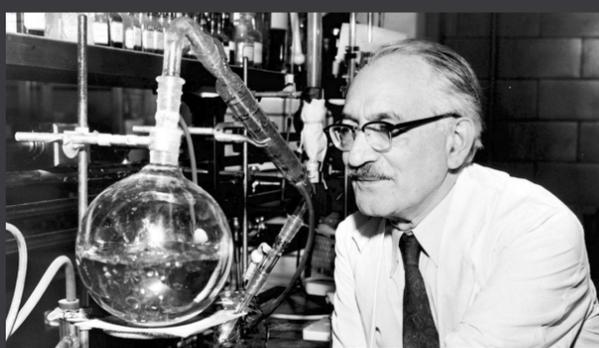
# FARMACOLOGÍA: ANTIBIÓTICOS



Dr. Miguel Basilio Robledo

## HISTORIA DE LOS ANTIBIOTICOS

propuesto por Wasman, descubridor de la estreptomina, para definir a las sustancias químicas producidas por diversas especies de microorganismos (bacterias, hongos y actinomicetos) que suprimen el crecimiento de otros microorganismos y causan su destrucción..



## CLASIFICACIÓN DE LOS ANTIBIÓTICOS

se clasifican en diferentes grupos: 1) por el efecto de su acción, 2) por su espectro de actividad, 3) por su estructura química y 4) según su mecanismo de acción.

### CLASIFICACIÓN SEGÚN SU ACCIÓN

se clasifican según el efecto de su acción sobre las bacterias en bacteriostáticos y bactericidas, lo cual depende de si la acción consiste en inhibir el crecimiento o lisis las bacterias, respectivamente.!

### CLASIFICACIÓN POR SU ESPECTRO DE ACTIVIDAD

La acción de un antibiótico se mide en términos de espectro bacteriano en amplio, medio y corto.

### CLASIFICACIÓN SEGÚN SU MECANISMO DE ACCION

inhiben la síntesis de la pared bacteriana y afectan la formación del polímero peptidoglucano que conforma la estructura de la pared bacteriana, entre los cuales se encuentran las penicilinas y las cefalosporinas.

## PENICILINAS

Las penicilinas son producidas por los hongos *Penicillium notatum* y *Penicillium chrysogenum*

### Clasificación

1. Penicilina G y penicilina V, las cuales actúan contra los cocos grampositivos y gramnegativos: estreptococos, neumococos y sífilis.
2. Penicilinas menos potentes actúan contra microorganismos sensibles a penicilinas G y V, pero muy potentes contra *Staphylococcus aureus* productor de penicilinas (dicloxacilina, oxacilina, meticilina, nafcilina, cloxacilina).
3. Penicilinas que actúan sobre microorganismos gramnegativos como *Haemophilus influenzae*, *E. coli*, *Proteus mirabilis* (ampicilina, amoxicilina, bacampicilina).
4. Otras penicilinas que actúan contra *Pseudomonas* y *Klebsiella* (ticarcilina, piperacilina y carbenicilina).

### Farmacocinetica

Su absorción es a través de la mucosa gastrointestinal, una vez absorbida se distribuye en el organismo, casi no es metabolizada y se elimina por los riñones.

### Indicación, dosis y presentación

Empleada sobre todo para infecciones por gérmenes grampositivos susceptibles, por lo regular en estreptococos en las infecciones leves o moderadas por estreptococos La dosis usual es de 250 a 500 mg cada 6 horas en los adultos y de 25 a 50 mg/kg/día en tomas fraccionadas para los niños. La penicilina V es dada en tabletas de 250 y 500 mg, polvo para reconstrucción de 125 y 250 mg/ 5 ml.



### Reacciones adversas

Inmediatas: entre ellas anafilaxis (con posibilidad de muerte súbita), urticaria, rinitis alérgica y edema angioneurótico.

Tardías en hasta 8% de los pacientes, como enfermedad del suero, diversos exantemas (macular, papular) y dermatitis exfoliativa, que suelen aparecer después de 10 días de tratamiento.

### Contra indicaciones

En pacientes alérgicos a las penicilinas

## CEFALOSPORINAS

antibiótico natural producido del hongo *Cephalosporium acremonium*. Son bactericidas que inhiben la síntesis de la pared bacteriana, al igual que las penicilinas.

### FARMACOCINETICA

administradas por vía oral y parenteral, se distribuyen en casi todos los tejidos del organismo y van unidas a las proteínas plasmáticas en forma reversible. Son metabolizadas en hígado y eliminadas en la bilis y orina.



LICENCIATURA EN MEDICINA HUMANA

# FARMACOLOGÍA: ANTIBIÓTICOS

Dr. Miguel Basilio Robledo



## Indicación, dosis y tratamiento

son usadas para profilaxis en cirugía ortopédica, abdominal y pelviana, y se emplean muchas veces en infecciones causadas por bacilos gramnegativos y cocos grampositivos.

### Reacciones adversas

suelen producir colitis pseudomembranosa, leucopenia, trombocitopenia y positividad de la prueba de Coombs. Ocurre dolor en el sitio de la inyección intramuscular y tromboflebitis tras la administración intravenosa

### Contraindicaciones

Están contraindicadas en pacientes alérgicos a la penicilina y en quienes se saben hipersensibles a ésta.

## CLASIFICACION DE LAS CEFALOSPORINAS

se clasifican en cuatro generaciones, basándose en su espectro de actividad antimicrobiano y de cuando fueron introducidas en el mercado. Los fármacos de primera y segunda generación no entran al sistema nervioso central.

### Primera generación

Cefalotina, cefazolina, cefalexina, cefadroxilo

### Segunda generación

Cefamandolil, cefaclor, cefuroxima, cefonicid,

### Tercera generación

Cefotaxima, ceftriaxona, ceftizoxima, ceftazidima

### Cuarta generación

Cefepima y cefpiroma

## 2. MEDICAMENTOS QUE INHIBEN LA SINTESIS DE PROTEINA A NIVEL RIBOSOMAL

se encuentran los que actúan sobre la subunidad 30S (aminoglucósidos y tetraciclinas) y los que trabajan sobre la subunidad 50S (macrólidos y cloranfenicol).

### Tetraciclinas

Antibióticos bacteriostáticos de amplio espectro muy relacionados entre sí, y similares en cuanto a espectro antibacteriano y toxicidad. Se les utiliza para tratar infecciones ocasionadas por Rickettsias, Mycoplasma pneumoniae, Chlamydia y Vibrio.

## Farmacocinetic

Su absorción es a nivel gástrico del intestino delgado. Se une a las proteínas plasmáticas en 50 a 70% y su vida media es de 7 horas. El contenido gástrico, en especial la leche y los antiácidos, disminuye su absorción.

## Indicacion, dosis y tratamiento

Es el fármaco de elección para el tratamiento de las infecciones por Rickettsias, como la fiebre manchada; infecciones por clamidias, como el linfogranuloma

La dosis que se administra es de 250 a 500 mg cada 6 horas en los adultos y de 25 a 50 mg/kg/día fraccionados en cuatro tomas para los niños mayores de ocho años de edad. La tetraciclina se presenta en forma de tabletas o cápsulas de 250 mg.

### Reacciones adversas

sobreinfección, reacciones cutáneas, disminución en el crecimiento óseo y alteración en el color de los dientes.

### Contraindicacion

La tetraciclina está contraindicada en niños menores de ocho años de edad

## CLORANFENICOL

Se le conoce como un antibiótico de amplio espectro de aparición natural debido a sus efectos sobre las bacterias grampositivas, gramnegativas y anaerobias

### Farmacocinetic

por vía oral, tópica y parenteral. Distribuido muy bien en la mayor parte de los tejidos del organismo, inclusive el líquido cefalorraquídeo. Se une a las proteínas plasmáticas en 50%. Su vida media es de 1 a 4 horas. Es metabolizado en hígado y eliminado a través de la bilis, orina y leche materna.

## Indicación, dosis y presentación

Fármaco de reserva en aquellos con infecciones graves, como meningitis bacteriana, fiebre tifoidea, enfermedades por rickettsia e infecciones por bacteroides

La dosis recomendada por vía oral es de 50 a 100 mg/kg/día dividida en cuatro tomas. En infecciones graves es necesario aplicarla vía intravenosa, dosis 100 mg/kg/día repartida cada 6 horas. El cloranfenicol se presenta en cápsulas de 250 y 500 mg

### Reacciones adversas

incluyen náuseas, vómito, diarrea, prurito anal, infecciones oportunistas, supresión de la médula ósea, confusión y depresión, anemia aplásica la cual, en general, es letal. En los lactantes produce un síndrome llamado síndrome del niño gris

### Contraindicaciones

Está contraindicado en los lactantes, en caso de insuficiencia hepática, depresión de médula ósea y durante la lactancia.



LICENCIATURA EN MEDICINA HUMANA

# FARMACOLOGÍA: ANTIBIÓTICOS

Dr. Miguel Basilio Robledo



## MACROLIDOS

bacteriostáticos y se unen a la subunidad 50S del ribosoma, inhibiendo así la síntesis de proteínas bacterianas. Resultan eficaces contra los cocos grampositivos aerobios y anaerobios. El grupo incluye eritromicina, claritromicina, azitromicina y roxitromicina.

## AMINOGLUCUCIDOS

actividad bactericida de amplio espectro. Sólo se muestran activos contra bacilos aerobios gramnegativos y estafilococo. Los fármacos que pertenecen al grupo son amikacina, tobramicina, gentamicina, kanamicina, neomicina, estreptomina y netilmicina.

se absorben mal por vía oral y deben usarse por vía parenteral para la infección sistémica. Se excretan sin cambios en la orina mediante filtración glomerular. Tienen la misma vida media en plasma de 2 a 3 horas. Todos los aminoglucósidos son nefrotóxicos y ototóxicos.

## 3. AGENTES QUE AFECTAN EL METABOLISMO DE LOS AC. NUCLEICOS QUINOLONAS

constituyen una clase de antibióticos sintéticos que actúan inhibiendo la síntesis bacteriana del DNA. Dichos fármacos poseen acción específica contra E. coli, Salmonella, Shigella y enterobacterias.

## Clasificación

Las quinolonas son clasificadas en tres generaciones cuyos representantes son el ácido nalidixico, la ciprofloxacina y la levofloxacina.

### Quinolonas de primera generación

Todas tienen actividad frente a bacterias gramnegativas, por sus características farmacocinéticas estos fármacos sólo son utilizados en el tratamiento de las infecciones de vías urinarias.

### Ácido nalidixico

#### Farmacocinética

Se administra por vía oral. Es absorbido en el tubo digestivo. Su metabolización ocurre en el hígado y es eliminado a través de orina y heces.

### Indicación, dosis y presentación

Se emplea para el tratamiento de las infecciones de vías urinarias agudas y crónicas. La dosis que debe administrarse es de 1 g cada 6 horas durante dos semanas. Se presenta en tabletas de 250 y 500 mg.

## Reacciones adversas

Alteraciones gastrointestinales, alteraciones hematológicas, cefalea, visión borrosa y erupción cutánea.

## Contraindicaciones

Durante la lactancia y en sujetos con aumento en la presión intracraneal (PIC).

### Quinolonas de segunda generación

pueden utilizarse en el tratamiento de cualquier tipo de infección siempre que la bacteria sea sensible, presentan una actividad frente a las bacterias gramnegativas y de forma más moderada frente a bacterias grampositivas.

### Ciprofloxacino

#### Farmacocinética

Por vía oral, tópica e intravenosa. Se absorbe en el tubo digestivo. Su distribución es amplia en los tejidos corporales. Su vida media plasmática es de alrededor de 5 horas. Es metabolizado en hígado y eliminado a través de orina y heces.

1. Infecciones de vías urinarias. Deben administrarse 250 a 500 mg cada 12 horas por dos semanas.
2. Infecciones gastrointestinales. Fiebre tifoidea, diarrea infecciosa y peritonitis. Infecciones de vías respiratorias como bronquitis aguda, fibrosis quística; infecciones de huesos y articulaciones; infecciones de piel y de tejidos blandos como las úlceras, las quemaduras y las heridas infectadas, los abscesos. Dosis de 500 mg cada 12 horas, si son graves se emplea 750 mg cada 12 horas o por vía IV 400 mg cada 12 horas durante dos semanas.

## Reacciones adversas

alteraciones gastrointestinales: náuseas, diarrea, vómito, dispepsia, dolor abdominal, colitis pseudomembranosa; vértigo, convulsión, erupciones cutáneas y alteraciones hematológicas

## Contraindicaciones

Está contraindicado en pacientes alérgicos a las quinolonas, durante el embarazo, la lactancia y en niños.

## Quinolonas de tercera generación

### LEVOFLOXACINO

#### Farmacocinética

Vía oral e intravenosa. Las concentraciones plasmáticas son alcanzadas después de 1 a 2 horas. Su vida media es de 6 a 8 horas. Se metaboliza muy poco en el organismo y es eliminado a través de la orina.

### Indicación, dosis y presentación

La dosis recomendada es de 500 mg, independiente de la vía de administración cada 24 horas



# FARMACOLOGÍA: ANTIBIÓTICOS



Dr. Miguel Basilio Robledo

## Reacciones adversas

Las más frecuentes son gastrointestinal, somnolencia, fatiga y toxicidad de cartílagos.

## Contraindicaciones

Está contraindicado en caso de hipersensibilidad durante el embarazo, la lactancia y en niños.

## 4. ANTIMETABOLITOS QUE ANTAGONIZAN LOS PASOS METABOLICOS EN LA SINTESIS DE ACIDO FOLICO

### Sulfonamidas

Antimicrobianos de origen sintético de amplio espectro con propiedades bacteriostáticas y bactericidas. Fueron los primeros quimioterápicos eficaces que se emplearon en forma sistémica para la prevención y curación de las infecciones bacterianas en el hombre.

## Clasificación

1. Agentes que son absorbidos y excretados con rapidez: sulfisoxazol y sulfadiazina.
2. Agentes que se absorben muy poco cuando se administran por vía oral, por lo que son activos en la luz intestinal: sulfasalazina.
3. Sulfas que son usadas de manera regular para uso tópico, como sulfacetamida y sulfadiazina de plata.
4. Sulfas de acción prolongada, que se absorben con rapidez, pero se excretan con lentitud.

## Farmacocinética

Son absorbidas con rapidez en el tracto gastrointestinal, a excepción de las preparadas en forma especial para sus efectos locales en el intestino.

## Indicación, dosis y presentación

Son utilizadas en infecciones de vías urinarias, toxoplasmosis, tracoma y conjuntivitis de inclusión, disentería

Sulfadiazina: adultos se usan 2 a 4 g seguidos de 4 a 8 g diarios en 4 a 6 dosis divididas. Está disponible en comprimidos de 500 mg.

Sulfametoxazol: En adultos es utilizada en infecciones leves a una dosis de 2 g seguida de 1 g cada 12 horas; en infecciones graves se emplean 2 g como dosis inicial y luego 1 g cada 8 horas. En niños es usada a una dosis de 50 a 60 mg/kg de peso, inicial

Sulfacetamida: Se administran 1 a 2 gotas de una solución a 30% cada 2 horas, aplicada de forma tópica en el ojo.

## Reacciones adversas

Alteraciones gastrointestinales: náuseas, vómito, anorexia y dolor abdominal; reacciones hematológicas, erupción cutánea, rash, dermatitis exfoliativa y fotosensibilidad, sobre todo en niños.

## Contraindicaciones

Contraindicadas en aquellos que presentan hipersensibilidad al compuesto, durante el embarazo, lactancia y niños menores de dos meses.

## Trimetoprim

Análogo estructural del ácido dihidrofólico e inhibe la dihidrofolato reductasa, unión de trimetoprim con sulfametoxazol produce un bloqueo secuencial de la síntesis del ácido fólico, resultando de una sinergia antibacteriana.

## Farmacocinética

Administrado por vía oral y parenteral. Su absorción es a través de la mucosa gastrointestinal, y las concentraciones plasmáticas son alcanzadas después de 2 a 3 horas. Es metabolizado en hígado y eliminado en orina.

## Indicación, dosis y presentación

La combinación trimetoprim-sulfametoxazol está indicada para el tratamiento de las infecciones causadas por Salmonella, Shigella, fiebre tifoidea resistente a cloranfenicol

La dosis que se administra por vía oral es de 480 mg 80 mg de trimetoprim y 400 mg de sulfametoxazol) cada 12 horas durante 10 días

## Reacciones adversas

Las reacciones adversas del medicamento con frecuencia comprenden erupción cutánea, náuseas, vómito, diarrea, anorexia, hepatitis y alteraciones hematológicas

## Contraindicaciones

Está contraindicado en pacientes con glomerulonefritis, hepatitis y durante la lactancia

## 5. Sustancias que actúan en forma directa sobre la MEMBRANA CELULAR DEL MICROORGANISMO

(nistatina y anfotericina B, que se unen a los esteroides de la pared celular).

**Anfotericina B** se usa para tratar infecciones micóticas como meningitis criptocócica (una infección micótica del recubrimiento de la columna vertebral y del cerebro) y leishmaniasis visceral (una enfermedad parasítica que por lo general afecta el bazo, el hígado y la médula ósea)

## Farmacocinética

Antibiótico antifúngico de acción bacteriostática del grupo de los macrólidos poliénicos, derivado de la cepa Streptomyces nodosus, un actinomiceto aerobio. Actúa alterando la permeabilidad de la membrana del hongo, al formar canales iónicos en la misma.

## Dosis

### Bibliografía

Manual de farmacología de pierre 7ta edicion mediante infusión intravenosa a una dosis de 1 a 2 mg/kg/hora.