



PASIÓN POR EDUCAR

NOMBRE DEL ALUMNO: Juan Carlos
López Gómez

NOMBRE DEL PROFESOR: Q.F.B Gladys
Elena Gordillo Aguilar.

NOMBRE DEL TRABAJO: Resumen
principales grupos de antibióticos

MATERIA: Microbiología y Parasitología

GRADO: Segundo semestre grupo A

Comitán de Domínguez Chiapas a 05 de Marzo de 2021

Resumen lectura de los principales grupos de antibióticos.

Dos descubrimientos originaron el comienzo de una nueva era de la quimioterapia y tratamientos de las infecciones, el primer descubrimiento fue en 1935 los efectos curativos del colorante rojo de Prontosil en las infecciones por estreptococos, el segundo descubrimiento edad de oro de la antibioticoterapia, nos referimos al descubrimiento de la penicilina y su posterior desarrollo. Ésta fue descubierta por Fleming en 1929 y en 1940 Florey, Chain y colaboradores, demostraron y publicaron un informe acerca de su enorme potencia y la posibilidad de su extracción de los sobrenadantes del cultivo del hongo *Penicillium notatum*.

Antimicrobiano: molécula natural (producida por un organismo vivo, hongo o bacteria), sintética o semisintética, capaz de inducir la muerte o la detención del crecimiento de bacterias, virus u hongos.

Los antibióticos constituyen un grupo heterogéneo de sustancias con diferente comportamiento farmacocinético y farmacodinámico, ejercen una acción específica sobre alguna estructura o función del microorganismo, tienen elevada potencia biológica actuando a bajas concentraciones, y la toxicidad es selectiva con una mínima toxicidad para las células de nuestro organismo.

Existen distintos tipos de clasificaciones para agrupar a estas moléculas:

De acuerdo a la interacción germen-antibiótico estos fármacos pueden dividirse en:

Bactericidas: su acción es letal, llevando a la lisis bacteriana;

Bacteriostáticos: a las concentraciones que alcanzan en el suero o tejidos impiden el desarrollo y multiplicación bacteriana, pero sin llegar a destruirlas.

Según el espectro de acción en:

Antibióticos de espectro amplio, como aquellos antibióticos que son activos sobre un amplio número de especies y géneros diferentes.

Antibióticos de espectro reducido, antibióticos solo activos sobre un grupo reducido de especies (penicilinas).

Según el mecanismo de acción

Es el mecanismo por el cual un antibiótico es capaz de inhibir el crecimiento o destruir una célula bacteriana, se dividen en inhibidores de la formación de la pared bacteriana, inhibidores de la síntesis proteica, inhibidores de la duplicación del DNA, inhibidores de la membrana citoplasmática, e inhibidores de vías metabólicas.

Los betalactámicos son un grupo de antibióticos de origen natural o semisintético, que se caracterizan por poseer en su estructura un anillo betalactámico. Actúan

inhibiendo la última etapa de la síntesis de la pared celular bacteriana. Constituyen la familia más numerosa de antimicrobianos y la más utilizada en la práctica clínica.

Clasificación

El espectro de los betalactámicos incluye bacterias Gram positivas, Gram negativas y espiroquetas. No son activos sobre los micoplasmas porque estos carecen de pared celular, ni sobre bacterias intracelulares como Chlamydia y Rickettsia. La resistencia natural de las micobacterias se debe a la producción de betalactamasas, probablemente unida a una lenta penetración por las características de la pared.

En cuatro grupos diferentes: penicilinas, cefalosporinas, monoatómicos y carbapenemes.

Penicilinas

Son un grupo de antibióticos de origen natural y semisintético que contienen el núcleo de ácido 6-aminopenicilánico, que consiste en un anillo betalactámico unido a un anillo tiazolidínico, los compuestos de origen natural son producidos por diferentes especies del hongo *Penicillium* spp.

De acuerdo a su origen y espectro de acción pueden clasificarse en: penicilinas naturales (G y V), penicilinas resistentes a las penicilinasas estafilocócicas (oxacilina, meticilina, dicloxacilina), aminopenicilinas (ampicilina, amoxicilina), carboxipenicilinas (carbenicilina, ticarcilina), ureidopenicilinas (piperacilina).

Cefalosporinas Son productos de origen natural derivados de productos de la fermentación del hongo *Cephalosporium acremonium*. Contienen un núcleo constituido por ácido 7-aminocefalosporánico formado por un anillo betalactámico, unido a un anillo de dihidrotiazina

Las cefalosporinas de primera generación son muy activas frente a los cocos Gram positivos; en líneas generales, las sucesivas generaciones han perdido parte de esa actividad, en beneficio de una mayor actividad frente a bacilos Gram negativos, con algunas excepciones. Todas las cefalosporinas son inactivas frente a enterococos, estafilococos resistentes a la meticilina y *Listeria monocytogenes*.

Monobactámicos Aztreonam, el único monobactámico disponible para uso clínico, posee una excelente actividad sobre bacterias Gram negativas aerobias y facultativas. Por el contrario, carece de actividad frente a Gram positivos y bacterias anaerobias.

Carbapenemes Son una clase única de betalactámicos que presentan el mayor espectro de actividad conocido dentro de este grupo de antibióticos. Imipenem es el primer carbapenem desarrollado para uso clínico. Es un derivado semisintético producido por *Streptomyces* spp. Otros compuestos más nuevos son meropenem y ertapenem. Su actividad bactericida se extiende a cocos Gram positivos incluyendo *Staphylococcus* spp. sensibles a meticilina, *Streptococcus pneumoniae* y otros

estreptococos. Solo carecen de actividad frente a los estafilococos resistentes a meticilina, enterococos resistentes a betalactámicos, algunas especies de *Pseudomonas* y *Stenotrophomonas maltophilia*.

Betalactámicos asociados a inhibidores de betalactamasas

Los llamados inhibidores de betalactamasas son moléculas que contienen en su estructura un anillo betalactámico. A las concentraciones alcanzadas en el plasma, no tienen casi ninguna acción antibiótica, con la excepción de sulbactam frente a *Acinetobacter baumannii*, pero presentan una gran afinidad por las betalactamasas. Estas son enzimas producidas por las bacterias que destruyen la actividad de determinados betalactámicos, de acuerdo al tipo de enzima. A estos compuestos, se los conoce como inhibidores suicidas, ya que inactivan la enzima por unión relativamente irreversible a la misma.

Glicopéptidos

Se trata de antibióticos que actúan sobre la pared bacteriana. Actualmente hay dos drogas en uso clínico: vancomicina y teicoplanina. La vancomicina es un antibiótico bactericida de espectro reducido (solo actúa sobre bacterias Gram positivas), que se obtiene de *Streptomyces orientalis*. Los glicopéptidos inhiben la última etapa de síntesis y ensamblado del peptidoglicano de la pared celular, mediante la formación de un complejo con la porción D-alanina-Dalanina del pentapéptido precursor.

Antibióticos que actúan inhibiendo la síntesis proteica

Aminoglucósidos, Se caracterizan por la presencia de dos o más aminoazúcares unidos por enlaces glucosídicos a un anillo aminociclitol. Los aminoglucósidos generalmente son activos frente a los estafilococos, si bien *Staphylococcus aureus* y los estafilococos coagulasa negativos resistentes a la meticilina también lo suelen ser a los aminoglucósidos, entran a la célula bacteriana por un mecanismo complejo que implica la adherencia a moléculas de carga negativa, como residuos del lipopolisacárido (LPS), cabezas polares de fosfolípidos y proteínas aniónicas de membrana externa. Luego de esta adherencia, por re-arreglo del LPS se produce la entrada al espacio periplásmico del agente. Al llegar a la membrana citoplásmica se produce el ingreso al citoplasma, por un sistema de transporte acoplado al gradiente protónico. Dicho gradiente depende de la actividad de las cadenas respiratorias aerobias.

Macrólidos

Los macrólidos (eritromicina, claritromicina, azitromicina), las lincosaminas (lincomicina y clindamicina), los cetólidos y las estreptograminas, son antibióticos que comparten un mecanismo de acción similar pero tienen estructura diferente. Se unen a la subunidad 50S del RNA ribosómico (rRNA) en forma reversible. La unión se realiza mediante la formación de puentes de hidrógeno entre diferentes radicales

hidroxilo del macrólido y determinadas bases del rRNA. Esto provoca un bloqueo en las reacciones de transpeptidación y traslocación del ribosoma bacteriano.

Lincosaminas

La clindamicina pertenece junto a la lincomicina, al grupo de las lincosaminas. La primera es un derivado sintético de la segunda, con mayor actividad, absorción gastrointestinal y espectro, por lo que tiene mayor uso en la práctica clínica.

Actúa inhibiendo la síntesis proteica bacteriana al unirse a la subunidad 50S, impidiendo la iniciación de la cadena peptídica. El sitio de unión al ribosoma es el mismo que para los macrólidos y cloranfenicol, inhibiendo sus acciones por competencia. Por lo tanto estos agentes son antagónicos y no deben ser usados a la vez.

Estreptograminas

Es un grupo de antibióticos formados por dos componentes: estreptogramina A y estreptogramina B. Un antibiótico a destacar de este grupo es el Quinupristin-dalfopristin, Quinupristin es el componente estreptogramina B y dalfopristin es el componente A. Ejercen su actividad a nivel del ribosoma bacteriano, donde el componente A se une al peptidil tRNA y bloquea la unión de nuevos aminoácidos, y el componente B impide la elongación de la cadena peptídica. El componente A aumenta la afinidad del componente B por la subunidad 50S ribosomal, siendo la combinación de A+B bactericida.

Oxazolidinonas

Es una clase de antibióticos enteramente sintéticos, en la cual el linezolid es el único disponible para uso clínico en humanos. Linezolid es un antibiótico bacteriostático. Inhibe los primeros pasos de la síntesis proteica mediante la unión a la subunidad ribosomal 50S en la zona de contacto con la subunidad 30S, impidiendo de este modo la formación del complejo de iniciación 70S.

Antibióticos que inhiben la replicación del dna

Quinolonas se trata de un grupo de antimicrobianos que derivan de una molécula básica formada por una doble estructura de anillo que contiene un residuo N en la posición 1. Diferentes sustituciones incluyendo la adición de residuos de flúor, han derivado desde el ácido nalidíxico hasta las quinolonas fluoradas.

Las quinolonas son antibióticos bactericidas y actúan inhibiendo las topoisomerasas, enzimas que catalizan el superenrollamiento del DNA cromosómico y que aseguran una adecuada división celular. Las quinolonas interactúan con dos sitios diferentes pero relacionados dentro de la célula bacteriana: la DNA girasa y la topoisomerasa IV. La primera es más sensible a la acción de las quinolonas en caso de gérmenes Gram negativos, mientras que en Gram positivos la más sensible es la topoisomerasa IV. Estos antibióticos se unen al complejo girasa DNA, una vez que la

girasa ya ha cortado al DNA para introducir, un supergiro negativo. El resultado neto es la pérdida del superenrollamiento negativo (forma fundamental de empaquetamiento del DNA bacteriano) lo que ocasiona lisis celular. Las quinolonas inhiben la síntesis de DNA y a concentraciones altas también la de RNA. Cuando interacciona con la DNA girasa, la inhibición ocurre rápidamente, mientras que cuando interacciona con la topoisomerasa IV la inhibición es más lenta. Este efecto es debido a la mayor afinidad de las quinolonas con los complejos DNA-topoisomerasa II.

Antibióticos que actúan inhibiendo la síntesis de ácido fólico

Las sulfonamidas fueron las primeras drogas eficaces empleadas para el tratamiento sistémico de infecciones bacterianas. Debido a la aparición de resistencia bacteriana y al descubrimiento de fármacos más activos y menos tóxicos, su uso se limitó durante un tiempo. Sin embargo actualmente, con la recuperación de la sensibilidad de algunas bacterias y la aparición de la combinación de trimetoprim y sulfonamidas que actúan de manera sinérgica, estos antibióticos han vuelto a ser usados. Son antibióticos bacteriostáticos que actúan alterando la síntesis del ácido fólico, lo cual repercute sobre la síntesis nucleotídica, con la consiguiente inhibición del crecimiento bacteriano. Por ser bacteriostáticos requieren de un sistema inmunológico indemne para erradicar la infección. Son inhibidores competitivos de la enzima dihidropteroato sintasa, encargada de la condensación del PABA y la pteridina para la formación del ácido fólico. El ácido fólico actúa como coenzima en la transferencia de grupos metilos a las bases purínicas y pirimidínicas para la síntesis del DNA y RNA.

Otros antibióticos

Rifampicina

Es un antibiótico semisintético, el cual inhibe la enzima RNA polimerasa DNA dependiente bacteriana, sin tener ningún efecto sobre su enzima homóloga humana. Es un agente bactericida, y su alta liposolubilidad favorece la penetración en el fagosoma. La resistencia antimicrobiana emerge rápidamente si se realizan tratamientos con este antibiótico como monodroga. Se utiliza en nuestro país como fármaco de primera línea para el tratamiento de la tuberculosis asociada a otros antibióticos, y como profilaxis en la meningitis producida por *N. meningitidis*.

Nitrofurantoína

Pertenece al grupo sintético de nitrofuranos, junto a furazolidona y nitrofurazona. Su acción bactericida se debe a la capacidad de unión a proteínas ribosomales, daño cromosómico e inhibición de la respiración y metabolismo del piruvato. Su actividad en muchos casos parece necesitar la reducción enzimática dentro de la célula bacteriana. Es una buena opción para el tratamiento de las infecciones urinarias bajas no complicadas.

Cloranfenicol

Es una agente de actividad bactericida, sobre microorganismos agentes de meningitis, tales como *N. meningitidis*, *H. influenzae* y *S. pneumoniae*, y bacteriostática frente a otros gérmenes. Su penetración en la célula requiere un proceso energía-dependiente, y una vez dentro inhibe la síntesis proteica por unión a la subunidad ribosomal 50S.

Tetraciclina

Las tetraciclinas son un grupo de agentes bactericidas activos sobre microorganismos Gram positivos y negativos, y patógenos intracelulares como clamidias, micoplasmas y rickettsias. Su mecanismo de acción se debe a la inhibición de la síntesis proteica por unión a la subunidad ribosomal 30S.

Bibliografía

I. Bado, N. C. (s.f.). *PRINCIPALES GRUPOS DE ANTIBIÓTICOS*. Recuperado el 2021 de Marzo de 05, de <file:///C:/Users/ENSERES/Downloads/Principales%20grupos%20de%20antibi%C3%B3ticos.pdf>