



**Nombre del alumno: Jhair Osmar
Roblero Díaz**

**Nombre del profesor: Gordillo Aguilar
Gladys Elena**

**Nombre del trabajo: resumen
(principales grupos de antibióticos)**

**Materia: microbiología y parasitología
I**

Grado: segundo semestre

Grupo: b

Principales grupos de antibióticos

Dos descubrimientos importantes el primero fue el descubrimiento en 1935 de los efectos curativos del colorante rojo de Prontosil en las infecciones por estreptococos. Este fue el precursor de las sulfonamidas. El segundo, fue el que dio inicio a la edad de oro de la antibioticoterapia, nos referimos al descubrimiento de la penicilina y su posterior desarrollo 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, 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 antibióticos pueden clasificarse de acuerdo a la forma en que producen la muerte o inhibición bacteriana, en antibióticos tiempo dependiente y concentración dependientes. En el caso del tiempo dependiente betalactámicos y macrólidos el éxito de la terapéutica viene dado por mantener concentraciones por encima de la CIM por el mayor tiempo posible interdosis T por encima de CIM. Los betalactámicos son un grupo de antibióticos de origen natural o semisintético, que se caracterizan por poseer en su estructura un anillo betalactámico. Se trata de compuestos de acción bactericida lenta, relativamente independiente de la concentración plasmática, que presentan escasa toxicidad y poseen un amplio margen terapéutico. Penicilinas los compuestos de origen natural son producidos por diferentes especies del hongo *Penicillium spp*, las penicilinas difieren unas de otras por sustituciones en la posición 6 del anillo, donde cambios en la cadena lateral pueden inducir modificaciones en la actividad antibacteriana y en las propiedades farmacocinéticas. La penicilina G benzatínica tiene una absorción lenta desde su depósito intramuscular manteniendo el efecto terapéutico hasta por 28 días. Esto determina que los niveles séricos alcanzados sean bajos, y por tanto solo es adecuada para el tratamiento de infecciones por gérmenes extremadamente sensibles como *Streptococcus pyogenes*, y para el tratamiento de la sífilis. Las penicilinas se distribuyen en muchos compartimentos como pulmones, hígado, músculo, hueso y placenta. La penetración en ojo, cerebro, líquido cefalorraquídeo LCR y próstata es pobre en ausencia de inflamación. En sangre los betalactámicos circulan como moléculas libres o unidas a las proteínas plasmáticas, relacionándose esta unión con la semivida del antibiótico, solo la fracción libre de la droga es activa y capaz de penetrar al

espacio extracelular. Cefalosporinas son productos de origen natural derivados de productos de la fermentación del hongo *Cephalosporium acremonium*. Farmacología. La mayoría de las cefalosporinas son de administración parenteral, aunque existe un número creciente de formulaciones para vía oral como la cefalexina, cefradina, cefadroxil, cefuroxime axetil y otras. La absorción gastrointestinal de estos compuestos es buena. Se obtienen buenas concentraciones en líquidos biológicos y suero. Carbapenemes farmacología estos compuestos son de administración parenteral. Mediante la administración intravenosa suelen alcanzarse con rapidez concentraciones plasmáticas elevadas. Se distribuyen ampliamente. El imipenem sufre inactivación por las hidroxipeptidasas renales, por ello se combina con cilastatina (inhibidor de hidroxipeptidasas), de manera de lograr concentraciones séricas adecuadas. Farmacodinamia los betalactámicos son antibióticos de actividad bactericida lenta, relativamente independiente de la concentración plasmática alcanzada, siempre que esta exceda la CIM del agente causal. 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. Los efectos adversos son poco frecuentes y generalmente de poca importancia clínica, ya que estos fármacos actúan sobre sustratos enzimáticos no presentes en las células eucariotas del hombre o de los animales. Poseen una cierta acción irritativa directa a nivel local, dependiendo de la vía de administración sobre el aparato digestivo, músculo o vena, pudiendo causar flebitis o miositis. Además su estructura favorece la aparición de manifestaciones de hipersensibilidad exantemas, edemas, hemólisis y con muy baja frecuencia pueden producir shock anafiláctico. Infección de piel y partes blandas. La penicilina V y amoxicilina pueden ser una opción para las infecciones producidas por *S. pyogenes* celulitis, erisipela, impétigo. En infecciones invasivas debe utilizarse penicilina G, y en presencia de un síndrome de sepsis o shock tóxico debe añadirse clindamicina por el mecanismo de acción que tiene esta droga frente a poblaciones no replicativas, inhibiendo además la síntesis proteica y por lo tanto la síntesis de toxinas. Infecciones de las vías respiratorias, la penicilina benzatínica por vía intramuscular en dosis única o la amoxicilina vía oral, constituyen el tratamiento de elección de la faringitis estreptocócica. La amoxicilina además, es un buen tratamiento empírico en casos de otitis media aguda. Otra opción es amoxicilina clavulánico cuando se trata de *Moraxella catarrhalis* o *Haemophilus influenzae* productor de betalactamasas. Endocarditis

bacteriana la penicilina es el antibiótico de elección en la endocarditis causada por *Streptococcus viridans*. En general se asocia a gentamicina durante la primera fase del tratamiento. En la endocarditis enterocócica se administra ampicilina más gentamicina empíricamente, y luego de conocer la sensibilidad se debe ajustar el tratamiento. Infecciones del sistema nervioso central. En la actualidad, la ceftriaxona y el cefotaxime son los antibióticos de elección en el tratamiento de la mayoría de pacientes con meningitis bacteriana de origen comunitario. Infección intraabdominal. El cefotaxime es una buena opción para el tratamiento de la peritonitis bacteriana espontánea, que suele presentarse en pacientes cirróticos con ascitis. La peritonitis secundaria es una infección polimicrobiana que suele incluir anaerobios y aerobios facultativos. La monoterapia con ampicilina sulbactam constituye una opción terapéutica razonable en los casos de inicio en la comunidad. Infección urinaria. El uso de amoxicilina-ácido clavulánico o ampicilina-sulbactam es una buena opción para el tratamiento de infecciones urinarias bajas no complicadas, los betalactámicos son los fármacos de primera línea para pacientes embarazadas. También se puede usar cefalosporinas de segunda y tercera generación para el tratamiento empírico de los casos de pielonefritis. Infecciones osteoarticulares. Los betalactámicos son el tratamiento de elección de un buen número de artritis sépticas, cefalosporinas de primera generación en las artritis estafilocócicas, penicilina en las estreptocócicas y ceftriaxona en las gonocócicas. Así, la oxacilina o las cefalosporinas de primera generación eran el tratamiento de elección en la osteomielitis estafilocócica. 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*. La vancomicina se administra por vía intravenosa, ya que se absorbe poco si se administra por vía oral, no se administra por vía intramuscular por el intenso dolor que causa en el sitio de inyección. 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, los enterococos son moderadamente resistentes a la gentamicina y la estreptomycinina. La combinación con penicilina, ampicilina o un glicopéptido actúa de forma sinérgica, excepto cuando las cepas son altamente resistentes a los aminoglucósidos. Los aminoglucósidos se unen de forma irreversible a la subunidad 30S del ribosoma, interfiriendo con la lectura correcta del código genético con el consiguiente bloqueo de la síntesis proteica de la bacteria. Los

aminoglucósidos pueden causar nefrotoxicidad, ototoxicidad y bloqueo neuromuscular, y en menor medida exantemas cutáneos, fiebre por antibióticos, depresión medular, anemia hemolítica y antagonismo del factor V de la coagulación. 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, el comportamiento farmacocinético es muy parecido entre los diferentes macrólidos. La eritromicina está disponible en preparaciones tópicas, intravenosas y por vía oral, la claritromicina y azitromicina vienen en presentaciones vía oral e intravenosa. La absorción intestinal de eritromicina y azitromicina se ve disminuida en presencia de comida, por lo que su administración debe ser alejada de las mismas. Los efectos secundarios más frecuentes de los macrólidos, y especialmente de eritromicina, son las molestias gastrointestinales dolor abdominal, náuseas y vómitos debidas a la actividad procinética de la misma eritromicina, y en especial de sus metabolitos formados en el medio ácido del estómago. Se observan con mayor frecuencia en la población menor de 40 años, especialmente cuando el antibiótico se administra por vía intravenosa en perfusión rápida. La tolerancia digestiva del resto de los macrólidos es superior a la de eritromicina, la administración de eritromicina a recién nacidos puede producir estenosis hipertrófica del píloro los macrólidos están indicados en pautas de tratamiento empírico de infecciones respiratorias y de piel y partes blandas adquiridas en la comunidad. En muchas de estas situaciones constituyen el tratamiento de elección como es el caso de la B. pertussis, mientras en otros casos constituyen el tratamiento de alternativa en pacientes alérgicos a la penicilina. 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. La clindamicina es activa contra casi todos los anaerobios, muchos de los cocos Gram positivos y algunos protozoarios, la clindamicina se absorbe un 90% por vía digestiva. Su volumen de distribución es amplio, alcanzando concentraciones clínicamente útiles en muchos tejidos y fluidos corporales, como hueso, líquido sinovial, pleura y peritoneo, las más comunes son diarrea (hasta en un 20% de los casos) y manifestaciones de hipersensibilidad. Su principal efecto adverso es la colitis pseudomembranosa producida por C. difficile, que puede ser mortal. Otros efectos secundarios son anorexia, vómitos, flatulencia, distensión abdominal y

en raras ocasiones aumento del nivel de transaminasas, no se recomienda su uso en la embarazada. La clindamicina se utiliza en caso de infecciones por gérmenes anaerobios donde puedan estar involucrados *B. fragilis* u otros anaerobios resistentes a penicilina. Se presenta como tratamiento útil para infecciones de origen dentario, supuración pulmonar bronquiectasias y abscesos pulmonares, e infecciones intraabdominales en combinación con antibióticos contra bacilos Gram negativos. Estreptograminas es un grupo de antibióticos formados por dos componentes estreptogramina A y estreptogramina B. Un antibiótico a destacar de éste grupo es el Quinupristin-dalfopristin Q-D. 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. Quinupristin-dalfopristin presenta efecto postantibiótico, en particular en organismos Gram positivos. Ambos componentes presentan una vida media muy corta menos de 1 hora. La metabolización ocurre a nivel hepático, con la producción de metabolitos con actividad antimicrobiana. Para evitar la irritación en el sitio de inyección que ocurre en un 30% de los casos debe administrarse diluido en suero glucosado al 5% y en infusión lenta. La administración de Q-D puede producir artromialgias, se utiliza en el tratamiento de infecciones por *E. faecium* resistente a vancomicina. También en infecciones de piel y tejidos blandos por *S. pyogenes* o *S. aureus* resistentes a meticilina, es eficaz en el tratamiento de neumonía nosocomial por *S. aureus*. Oxazolidinonas es una clase de antibióticos enteramente sintéticos, en la cual el linezolid es el único disponible para uso clínico en humanos, es activo contra la mayoría de los Gram positivos de importancia clínica como *S. aureus*, *E. faecium*, *E. faecalis*, *S. pneumoniae*, *S. pyogenes*. Presenta actividad contra algunos anaerobios y algunas micobacterias. Es prácticamente inefectivo frente a gérmenes Gram negativos a excepción de *N. meningitidis* y *H. influenzae*, la forma de administración puede ser oral o intravenosa. Presenta una rápida absorción, con una biodisponibilidad cercana al 100%. Los efectos adversos más frecuentes son a nivel digestivo causando diarrea, náuseas y vómitos. A nivel hematológico pueden producir mielosupresión, lo que se observa en tratamientos mayores a dos semanas, siendo reversible con la supresión de la administración del fármaco. 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 un 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.). Obtenido de Principales grupos de antibióticos. Disponible:

file:///C:/Users/Alejandro/Downloads/Principales%20grupos%20de%20antibi%C3%B3ticos.pdf