

UNIVERSIDAD DEL SURESTE.

MATERIA:

TERAPEUTICA FARMACOLOGICA.

UNIDAD A EVALUAR:

UNIDAD 3.

TEMA DEL TRABAJO:

RESUMEN DE QUINOLONAS Y LINCOSAMIDAS.

NOMBRE DEL DOCENTE:

DR. ALFREDO LOPEZ.

NOMBRE DE LA ALUMNA:

JALIXA RUIZ DE LA CRUZ.

QUINOLONAS.

Las quinolonas son un grupo de agentes quimioterapéuticos (agentes con actividad antimicrobiana con toxicidad selectiva) sintéticos, es decir, que no son producidos por microorganismos, a diferencia de los antibióticos. La mayor parte de las quinolonas usadas en la clínica son del grupo de las fluorquinolonas (o fluoroquinolonas), caracterizadas por tener un grupo fluoruro en el anillo central, normalmente en posición 6.

Las quinolonas de primera y segunda generación inhiben selectivamente el dominio ligasa de la ADN girasa bacteriana (topoisomerasa II) dejando intacto el dominio nucleasa. La actividad de la ADN girasa en bacterias gram negativas es constante y esencial para el mantenimiento de la topología del ADN bacteriano. La actividad nucleasa sin la acción acompañada del dominio ligasa produce la fragmentación del ADN bacteriano. Las quinolonas de tercera y cuarta generación son más selectivas al dominio ligasa de la topoisomerasa IV, por lo tanto, son más adecuadas para cubrir infecciones de bacterias gram positivas. Interrumpe la reproducción bacteriana y la replicación del ácido ribonucleico, se necesita que estén separados los dos cordones de la doble hélice del ADN. Sin embargo, todo lo que separe los cordones ocasiona un desenrollado o un superenrollado positivo excesivo del ADN. Este proceso es regulado por la ADN girasa, la cual se encarga de la introducción continua de superespiras negativas, lo que alivia el enrollamiento del ADN. El grupo antibiótico quinolonas bloquea la actividad de la subunidad A de la ADN girasa bacteriana (topoisomerasa II). Tienen una acción bactericida rápida, que es dosis dependiente (en relación con la concentración del antibiótico). Las quinolonas interfieren en la replicación del ADN al bloquear o inhibir las enzimas topoisomerasa II y topoisomerasa IV, enzimas esenciales para la topología del ADN.

Las quinolonas se absorben adecuadamente una vez ingeridas y se distribuyen de manera amplia en los diversos tejidos corporales. Después de ingerir los fármacos, los alimentos no aminoran la absorción, pero pueden prolongar el lapso que media hasta que se alcanzan las concentraciones máximas. La dosis depende de la

quinolona administrada. La biodisponibilidad de las fluoroquinolonas excede de 50 por ciento con todos los medicamentos; con algunos rebasa el 95 por ciento. La vida media plasmática varía de 3 a 5 horas, con el norfloxacin y el ciprofloxacino, hasta 20 horas con la esparfloxacina. El volumen de distribución es grande y las concentraciones en la orina son mayores que las observadas en el suero.

La incidencia de este efecto es especialmente rara, con menos de un caso por 10 000 personas/año.

- ✚ Neuropatía periférica (daño nervioso). Se han observado casos raros de polineuropatía axonal sensorial o sensorial motora que genera parestesias, hipoestesis, disestesia y debilidad en pacientes que consumen quinolonas.
- ✚ Daño tendinoso. En pacientes que reciben tratamiento con quinolonas se ha observado ruptura de los tendones del hombro, de la mano, del tendón de Aquiles o de otros tendones que requieren intervención quirúrgica o que generan una discapacidad prolongada.
- ✚ Las quinolonas en pediatría están contra indicadas antes de los 14 años, debido a su efecto sobre el cartílago en crecimiento sobre el cual producen cierre precoz.

LINCOSAMIDAS.

Lincosamidas (ej. lincomicina, clindamicina) son una clase de antibióticos que se unen a la porción 23s de la subunidad 50S del ribosoma bacteriano inhibiendo la replicación temprana de la cadena peptídica a través de la inhibición de la reacción de la transpeptidasa. La clindamicina es un derivado semisintético de la lincomicina que difiere estructuralmente de este compuesto por la sustitución de un átomo de cloro por un grupo hidroxilo y la inversión del carbono en la posición 7 involucrada. Tienen una acción similar a los macrólidos.

Las lincomicinas pueden actuar como bacteriostáticos o bactericidas, dependiendo de la concentración del fármaco que se alcance en el sitio de infección y la susceptibilidad del microorganismo infectante. Estos fármacos parecen ejercer sus

efectos mediante la unión a las subunidad ribosomal 50s, inhibiendo la síntesis de proteínas bacterianas. Este mecanismo de acción de las lincomicinas es compartido por otros grupos de antibióticos como los fenicoles (Cloranfenicol) y los Macrólidos (Eritromicina, Claritromicina y Azitromicina). Por lo cual actúan como antagonistas no debiendo ser usados concomitantemente. La lincomicina y la clindamicina tienen un espectro antibacteriano similar, sin embargo la lincomicina es en general menos activa contra los microorganismos que son susceptibles a la clindamicina.

Los efectos adversos gastrointestinales son frecuentes con el uso oral y parenteral de las lincosamidas. Estos pueden consistir en náuseas, vómito, diarrea, dolor abdominal y tenesmos. Sin embargo lo grave es que pueden producir una diarrea asociada a *Clostridium difficile* y Colitis pseudomembranosa. Adicionalmente puede causar: bloqueo neuromuscular y el Síndrome de Stevens-Johnson.