

QUINOLONAS

Las quinolonas son antibióticos bacteriolíticos por su actividad sobre el ADN. Tienen amplio espectro de actividad que incluye grampositivos, gramnegativos, anaerobios y bacterias intracelulares. Alcanzan altas concentraciones séricas y tisulares y sirven para las infecciones de la mayoría de los tejidos, incluso aquellas del nervioso central. Los efectos adversos son poco frecuentes.

Mecanismo de acción Penetran en el interior de la bacteria al aumentar la permeabilidad de la pared, entonces actúan sobre la topoisomerasa II, una de las enzimas ADN-girasas que induce el desenrollamiento del ADN para que éste pueda pasar a la forma lineal y cumplir, de esa manera, con sus funciones específicas. En las bacterias, esta topoisomerasa está formada por 4 subunidades (2 A y 2 B). Las quinolonas se unen al sitio específico donde debía unirse la subunidad A y a la propia girasa y forma un complejo que interfiere su acción reparadora final del proceso de superenrollamiento. A consecuencia de ello, el ADN no reparado pierde su estructura y, como en su forma lineal carece de espacio suficiente dentro de la bacteria, ahora ésta adquiere una forma filamentosa. Además, se considera que podría haber liberación de polisacáridos de membrana que aumentan la permeabilidad, alteraciones en la síntesis de ARN y de proteínas, producción de exonucleasas y cambios en la superficie celular bacteriana. Por todas estas razones se produce una lisis del cuerpo celular de la bacteria y se concreta la acción bactericida de estas drogas.

Las quinolonas de uso clínico tienen una estructura formada por dos anillos, con un nitrógeno en la posición 1, un grupo carbonilo en la posición 4 y un grupo carboxilo en la posición 3. La potencia y el espectro aumentan de manera significativa cuando llevan un átomo de flúor en la posición 6, posiblemente porque mejora la penetración en tejidos y la unión a las topoisomerasas bacterianas. Frente a bacterias gramnegativas también aumenta la potencia si en la posición 7 hay un grupo piperacínico (norfloxacino, ciprofloxacino) o un grupo metilpiperacínico (ofloxacino, levofloxacino, gatifloxacino). Además, sustituyentes metilo en el grupo piperacínico mejoran la biodisponibilidad oral. Los compuestos

que llevan en la posición 7 un doble anillo derivado del anillo pirrolidónico aumentan su actividad sobre bacterias grampositivas (moxifloxacino). Un grupo metoxi en la posición 8 mejora la actividad frente a anaerobios (moxifloxacino, gatifloxacino)

Entre las indicaciones para el uso de quinolonas se encuentran las siguientes; infecciones del tracto urinario (ITU) no complicadas (principalmente cuando existe resistencia contra el tratamiento de primera línea), ITU complicadas, prostatitis bacteriana crónica, infecciones de transmisión sexual (ITS) e infecciones

Efectos gastrointestinales. ...

Sistema nervioso central. ...

Reacciones dérmicas. ...

Alteraciones analíticas. ...

Alargamiento del intervalo QT en el electrocardiograma. ...

Tendinitis y rotura de tendones. ...

Infecciones del tracto urinario complicadas. ...

Prostatitis.

LINCOSAMIDAS

Las lincosamidas (lincomicina y clindamicina) tienen una actividad microbiológica muy parecida a la de los macrólidos. Como ellos, inhiben la síntesis proteica a nivel del ribosoma 50S. Los cocos grampositivos y los bacteroides constituyen el blanco de elección de las lincosamidas. Los bacilos gramnegativos y los enterococos (excepto *Enterococcus faecium*) son naturalmente resistentes. El mecanismo esencial de resistencia es la metilación de la adenina a nivel del ácido ribonucleico ribosomal 23S, en la subunidad 50S del ribosoma. Dicho mecanismo se trasmite por plásmidos y lleva a la resistencia macrólido-lincosamida-

estreptogramina B. La absorción digestiva de la clindamicina es del 90%. El pico no está afectado por la alimentación. Tras la administración de una dosis de 150 y 300 mg, se obtiene el pico en 1 hora; en ese momento, las concentraciones séricas son respectivamente de 2,5 y 3,6 mg/l. La clindamicina se difunde bien en los tejidos y líquidos del organismo, con excepción del líquido cefalorraquídeo. El principal efecto indeseable es la diarrea, por lo general moderada, en el 20% de los pacientes que reciben el antibiótico por vía oral. En un 0,01-10% de los pacientes se señalan colitis pseudomembranosas debidas a *Clostridium difficile*. Todas las infecciones con componentes tisulares debidas a bacterias sensibles a las lincosamidas son indicaciones posibles. Las infecciones por estafilococos o estreptococos son indicaciones electivas, así como las infecciones anaerobias, mono o polimicrobianas, que implican anaerobios y cocos grampositivos.

náusea,

vómitos,

sabor desagradable o metálico en la boca,

dolor de articulaciones,

dolor al tragar,

acidez,

parches blancos en la boca,

flujo vaginal blanco y espeso,

ardor, picazón e inflamación de la vagina.