



UNIVERSIDAD DEL SURESTE

PRESENTA

Lucía Guadalupe Zepeda Montúfar

CUARTO SEMESTRE EN LA LICENCIATURA DE MEDICINA HUMANA

TEMA: "Aminoglucosidos y macrolidos".

ACTIVIDAD: Resumen

ASIGNATURA: Terapéutica farmacológica.

UNIDAD III

CATEDRÁTICO: Dr. Alfredo López López

TUXTLA GUTIÉRREZ; CHIAPAS A 09 DE MAYO DEL 2021

## AMINOGLUCÓSIDOS

**DEFINICIÓN:** Se usan más ampliamente en combinación con otros agentes para tratar organismos resistentes a los medicamentos. **Incluyen:** estreptomina, neomicina, kanamicina, amikacina, gentamicina, tobramicina, sisomicina, netilmicina y otros.

**MECANISMO DE ACCIÓN:** El evento inicial es la difusión pasiva mediante canales de porina a través de la membrana externa. El fármaco se transporta luego activamente a través de la membrana de la célula hasta el citoplasma por un proceso dependiente del oxígeno. El gradiente electroquímico transmembrana suministra la energía para este proceso, y el transporte se acopla a una bomba de protones. El bajo pH extracelular y las condiciones anaeróbicas inhiben el transporte al reducir el gradiente. El transporte puede potenciarse mediante fármacos activos para la pared celular como penicilina o vancomicina; esta mejora puede ser la base de la sinergia de esos antibióticos con los aminoglucósidos. Dentro de la célula, los aminoglucósidos se unen a las proteínas ribosómicas de la subunidad 30S. Los aminoglucósidos inhiben la síntesis de proteínas en al menos tres formas:

- 1) interferencia con el complejo de iniciación de la formación de péptidos.
- 2) lectura incorrecta del mRNA que causa la incorporación de aminoácidos incorrectos en el péptido y trae como resultado una proteína no funcional.
- 3) separación de polisomas en monosomas no funcionales.

Estas actividades ocurren más o menos simultáneamente, y el efecto general es irreversible y conduce a la muerte celular.

**INDICACIONES:** Se usan principalmente contra las bacterias gramnegativas aerobias, especialmente cuando existe preocupación por patógenos resistentes a los medicamentos, o en pacientes críticamente enfermos.

**EFFECTIVIDAD SOBRE AGENTES:** Se usan con un antibiótico betalactámico en infecciones graves por bacterias gramnegativas, con un antibiótico betalactámico o vancomicina para la endocarditis grampositiva, y con uno o más agentes para el tratamiento de infecciones por micobacterias, como la tuberculosis.

**EFFECTOS ADVERSOS:** Todos los aminoglucósidos son ototóxicos y nefrotóxicos. El uso concomitante con diuréticos de asa (p. ej., furosemida, ácido etacrínico) u otros agentes antimicrobianos nefrotóxicos (p. ej., vancomicina o anfotericina) puede potenciar la nefrotoxicidad y, de ser posible, debe evitarse. La ototoxicidad puede manifestarse como daño auditivo, que origina tinnitus y pérdida auditiva de alta frecuencia inicialmente, o como daño vestibular con vértigo, ataxia y pérdida de equilibrio.

## MACRÓLIDOS

**DEFINICIÓN:** Son un grupo de compuestos estrechamente relacionados caracterizados por un anillo de lactona macrocíclica (que por lo general contiene 14 o 16 átomos) a los que se unen los azúcares desoxi.

**MECANISMO DE ACCIÓN:** Puede ser inhibidora o bactericida, particularmente en concentraciones más altas, para organismos susceptibles. La actividad se mejora a pH alcalino. La inhibición de la síntesis de proteínas se produce mediante la unión al ácido ribonucleico del ribosoma 50S. El sitio de unión está cerca del centro peptidiltransferasa, y el alargamiento de la cadena peptídica (es decir, transpeptidación) se previene bloqueando el túnel de salida del polipéptido. Como resultado, peptidil-tRNA se disocia del ribosoma.

## INDICACIONES

<ul style="list-style-type: none"> <li>Eritromicina</li> </ul>	<ul style="list-style-type: none"> <li>Previene la síntesis de proteínas bacterianas uniéndose a la subunidad ribosómica 50S</li> </ul>	Actividad bacteriostática contra bacterias susceptibles	Neumonía adquirida en la comunidad <ul style="list-style-type: none"> <li>• pertussis</li> <li>• infecciones corinebacteriana y por clamidia</li> </ul>	Oral, IV • aclaramiento hepático (semivida 1.5 h) • dosificado cada 6 h <ul style="list-style-type: none"> <li>• inhibidor del citocromo P450</li> <li>• <i>Toxicidad:</i> malestar gastrointestinal, hepatotoxicidad, prolongación del QTc</li> </ul>
--	---	---	---	--

- Clarithromicina:* oral; más semivida (6 h) tan dosificado dos veces diario; adicional actividad versus complejo M. avium, toxoplasma y M. leprae.
- Azithromicina:* oral, IV; muy larga semivida (68 h) permite para una vez al día dosificación y 5 días curso de terapia de neumonía adquirida en la comunidad; no inhibe las enzimas del citocromo p450
- Telitromicina:* oral; no afectado por la resistencia mediada por eflujo, por lo que es activo frente a muchas cepas de neumococos resistentes a la eritromicina; casos raros de insuficiencia hepática fulminante

**EFFECTIVIDAD SOBRE AGENTES:** Presentan buena actividad frente a cocos aerobios grampositivos, algunos aerobios gramnegativos y ciertos microorganismos anaerobios. Los nuevos compuestos poseen mayor actividad contra bacterias “atípicas” e incluso espiramicina es activa frente a algunos protozoarios.

**EFFECTOS ADVERSOS:** La anorexia, las náuseas, los vómitos y la diarrea son frecuentes. Otras reacciones alérgicas incluyen fiebre, eosinofilia y erupciones.