

Daniela Rocío Villarreal Cerdios

Licenciatura en Enfermería

Farmacología

**Catedrático: Lic. María José
Hernández Méndez**



Características

Los macrólidos se utilizan como fármacos alternativos para pacientes alérgicos a antibióticos como: penicilinas. en los casos de hipersensibilidad, resistencia, necesidad de cubrimiento antibacteriano frente a gérmenes intracelulares.

Los fármacos denominados macrólidos tienen la ventaja de presentar pocos efectos secundarios o adversos una vez iniciado el tratamiento.

La clasificación de los macrólidos químicamente se caracteriza por el número de átomos en el anillo macrolactónico.



Clasificación

Desde un punto de vista químico pueden considerarse tres grupos de macrólidos:

- ➔ **Los que poseen un anillo lactónico de 14 átomos:** eritromicina, oleandomicina, roxitromicina, claritromicina, diritromicina y fluritromicina.
- ➔ **Los que presentan un anillo lactónico de 15 átomos:** azitromicina.
- ➔ **Los que poseen un anillo de 16 átomos:** espiramicina, josamicina, diacetilmidecamicina y rokitamicina.

Estas diferencias químicas justifican las peculiaridades farmacológicas y bacteriológicas de los distintos preparados



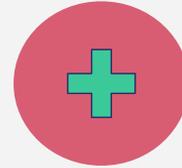


Mecanismo de Acción



Síntesis de Proteínas

Los macrólidos inhiben la síntesis de proteínas a nivel de las subunidades 50s de los ribosomas bacterianos, bloqueando las enzimas que actúan en la translocación de la cadena proteica.



Tiempo

Los macrólidos se caracterizan por requerir 2-4 veces la concentración mínima inhibitoria (CMI) para conseguir la concentración mínima bactericida (CMB) y que esta concentración debe mantenerse durante el tiempo suficiente, puesto que el efecto bactericida es tiempo-dependiente.



Bactericida

El efecto de los macrólidos puede ser bacteriostático o bactericida, dependiendo de la especie bacteriana sobre la que actúen, del tamaño del inóculo, de la fase de crecimiento en que se encuentren las bacterias y de la concentración que alcance el antibiótico en el lugar de la infección.



Translocación

Los macrólidos del grupo de la eritromicina bloquean el proceso de traslocación del peptidil-ARNt en el ribosoma, mientras que los del grupo de la espiramicina inhiben la formación del enlace peptídico previo al proceso de traslocación.





Farmacocinética



Los macrólidos difunden fácilmente y se absorben bien por vía oral. La eritromicina base es altamente susceptible a la degradación por el ácido gástrico.

La presencia de alimento en el tracto gastrointestinal puede modificar la absorción, en mayor o menor grado, dependiendo de la formulación antibiótica.

Una de las propiedades más relevantes de los macrólidos es su gran volumen de distribución. Se concentran en tejidos y son capaces de acumularse dentro de células eucariotas.

01

02

03

04

05

06

Las concentraciones tisulares y celulares alcanzadas son altas, siendo una gran ventaja para el tratamiento de infecciones localizadas a este nivel.

La penetración de estos compuestos en el sistema nervioso central es limitada y solo se alcanzan concentraciones bajas que no superan los valores terapéuticos. Los macrólidos son metabolizados a nivel hepático por el sistema de citocromo.

La eliminación es principalmente biliar aunque también hay pérdida por materia fecal y orina. En el caso de eritromicina, la excreción urinaria es muy baja. Azitromicina es eliminada muy lentamente, probablemente por la retención a nivel celular o la unión estrecha a fosfolípidos.





Farmacodinamia



- La Eritromicina base administrada por vía oral es inactivada por el jugo gástrico por lo que se requiere la administración en tabletas con cubierta entérica y en forma de sal (estearato, etilsuccinato, laurilsulfato).



La Roxitromicina tiene la biodisponibilidad más alta (75-85%) frente a la claritromicina (55%) y Azitromicina (37%). Dada su liposolubilidad se difunden bien en tejido bronquial, próstata, oído medio y hueso pero pobremente en líquido cefalorraquídeo. La Roxitromicina alcanza concentraciones, por encima de la CIM en los patógenos responsables de infecciones estomatológicas.



Los macrólidos alcanzan altas concentraciones intracelulares en polimorfeonucleares y macrófagos alveolares por lo cual son útiles en infecciones por patógenos intracelulares



La vida media de la Eritromicina es de 1.5 horas, la Claritromicina 4.0 horas, de la Azitromicina 68 horas y la Roxitromicina 19 horas lo que facilita la administración de estas dos últimas en una sola dosis diaria.



Gracias!!

