

# MACRÓLIDOS

## FUNCIÓN

Los macrólidos son un grupo de compuestos estrechamente relacionados que se caracterizan por un anillo de lactona macrocíclica (por lo general contiene 14 o 16 átomos) a los cuales se unen los azúcares desoxi. El fármaco prototipo, la eritromicina, que consiste en dos restos de azúcar unidos a un anillo de lactona de 14 átomos, se obtuvo en 1952 de *Streptomyces erythreus*, ahora llamado *Saccharopolyspora erythraea*. La claritromicina y la azitromicina son derivados semisintéticos de la eritromicina.

## MECANISMO DE ACCIÓN

La acción antibacteriana de la eritromicina y otros macrólidos 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 (RNA ribonucleic acid) del ribosoma 50S.

## FARMACOCINÉTICA

La base de eritromicina es destruida por el ácido estomacal, y debe administrarse con un recubrimiento entérico; la comida interfiere con su absorción. Las formulaciones de estearato y etilsuccinato son bastante resistentes a los ácidos y se absorben mejor..

## INDICACIONES

La eritromicina es un fármaco tradicional de elección en las infecciones por corinebacterias (difteria, sepsis corinebacteriana, eritrasma) y en las infecciones por clamidia respiratoria, neonatal, ocular o genital. Si bien fue utilizada en el tratamiento de la neumonía adquirida en la comunidad es porque su espectro de actividad incluye neumococos, *M. pneumoniae* y *L. pneumophila*, los macrólidos más nuevos se toleran mejor y se seleccionan más. La resistencia a macrólidos está aumentando en neumococos y *M. pneumoniae*. .

## REACCIONES ADVERSAS

La anorexia, náuseas, vómito y diarrea son frecuentes. La intolerancia gastrointestinal, que se debe a una estimulación directa de la motilidad intestinal, es la razón más común para seleccionar una alternativa a la eritromicina. Este efecto secundario en realidad es deseable en algunas circunstancias, lo que lleva a que, aunque no es una indicación designada en la etiqueta del fármaco, se emplea la eritromicina para tratar a los pacientes con gastroparesia.

# Carbapenémicos

## FUNCIÓN

Los carbapenémicos son lactámicos  $\beta$  que contienen un anillo lactámico  $\beta$  fusionado y un sistema de anillo de cinco miembros que difiere de las penicilinas porque es insaturado y contiene un átomo de carbono en lugar del átomo de azufre. Esta clase de antibióticos tiene un espectro de actividad más amplio que la mayoría de los otros antibióticos lactámicos  $\beta$ .

Los fármacos incluidos dentro del grupo son el **imipenem, meropenem y ertapenem**.

## FARMACODINAMIA

Es bactericida y actúa de igual modo inhibiendo la síntesis bacteriana de la pared celular.

## FARMACOCINÉTICA

Dependiendo individualmente del producto, se administra por vía parenteral junto con la cilastatina, un inhibidor de la hidrolasa renal I, la cual inhibe el metabolismo renal del imipenem. Las concentraciones plasmáticas son alcanzadas después de 20 minutos, se une muy poco con las proteínas plasmáticas, es metabolizado en hígado y eliminado en la orina en 70% y por el hígado 30%.

## INDICACIONES

- Haemophilus influenzae
- Anaerobios
- La mayoría de Enterobacterales (incluso las que producen beta-lactamasas de tipo AmpC y beta-lactamasas de espectro extendido [ESBL], aunque el Proteus mirabilis tiende a tener concentraciones inhibitorias mínimas [CIM] más altas para imipenem)
- Estafilococos y estreptococos sensibles a la meticilina, incluso Streptococcus pneumoniae (excepto posibles cepas con sensibilidad reducida a las penicilinas)

## REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas más frecuentes son vómitos, diarrea, dolor abdominal, elevación transitoria de las enzimas hepáticas y convulsiones por aplicación de dosis altas

## MECANISMO DE ACCIÓN

Impide que la bacteria forme la pared celular bacteriana (peptidoglucano)

## IMIPENEM

El imipenem es el prototipo del grupo, fue el primer carbapenem introducido en el mercado. Su espectro de acción es amplio e incluye a microorganismos grampositivos y gramnegativos, aerobios y anaerobios. Antibiótico de elección en infecciones graves producidas por **S. aureus y S. epidermidis, Streptococcus pneumoniae, Clostridium difficile**

# QUINOLONAS

## FUNCIÓN

Las quinolonas constituyen una clase de antibióticos sintéticos que actúan inhibiendo la síntesis bacteriana del DNA

## MECANISMO DE ACCIÓN Y FARMACODINAMIA

. El sitio primario de las quinolonas es la DNA girasa que previene la relajación del DNA superenrollado de manera positiva que se requiere para la transcripción normal y para la replicación. Dichos fármacos poseen acción específica

## CLASIFICACIÓN

De acuerdo con sus rasgos generacionales, las quinolonas son clasificadas en tres generaciones cuyos representantes son el ácido nalidíxico, la ciprofl oxacina y la levofl oxacina.

## QUINOLONAS DE 1RA GENERACIÓN

Todas tienen actividad frente a bacterias gramnegativas, por sus características farmacocinéticas estos fármacos sólo son utilizados en el tratamiento de las infecciones de vías urinarias

### ÁCIDO NALIDÍXICO

Actúa interrumpiendo la duplicación del DNA bacteriano. Farmacocinética: Se administra por vía oral. Es absorbido en el tubo digestivo. Su metabolización ocurre en el hígado y es eliminado a través de orina y heces.

## QUINOLONAS DE 2DA GENERACIÓN

Todas estas quinolonas pueden utilizarse en el tratamiento de cualquier tipo de infección siempre que la bacteria sea sensible, presentan una actividad frente a las bacterias gramnegativas y de forma más moderada frente a bacterias grampositivas. Los fármacos incluidos en el grupo son ciprofl oxacino, norfl oxacina, ofl oxacina, profl oxacina y otros.

### CIPROFLOXACINO

La acción bactericida del ciprofl oxacino proviene de la inhibición de la enzima DNA girasa, enzima responsable de la síntesis del DNA bacteriano, lo que evita la transcripción y la replicación bacteriana. Farmacocinética Se administra por vía oral, tópica e intravenosa.

## QUINOLONAS DE 3RA GENERACIÓN

Todos los medicamentos del grupo presentan una gran actividad antibacteriana, que incluye bacterias resistentes a los fármacos de las restantes generaciones. Este grupo contiene a levofl oxacino, moxifl oxacina, gatifl oxacina, lomefl oxacina, temafl oxacina, profl oxacina, fl eroxacina y otros.

**Reacciones adversas:** Las más frecuentes son gastrointestinal, somnolencia, fatiga y toxicidad de cartílagos. **Contraindicaciones:** Está contraindicado en caso de hipersensibilidad durante el embarazo, la lactancia y en niños

# Bibliografía

MANUAL DE FARMACOLOGÍA  
BÁSICA Y CLÍNICA. PIERRE  
MITCHEL ARISTIL CHÉRY.  
MCGRAW-HILL INTERAMERICANA,  
2013 - PHARMACOLOGY - 319  
PAGES.

MLA CITATION. GOODMAN &  
GILMAN: LAS BASES  
FARMACOLÓGICAS DE LA  
TERAPÉUTIC, 13E BRUNTON LL,  
CHABNER BA, KNOLLMANN BC.  
BRUNTON L.L., & CHABNER B.A., &  
KNOLLMANN B.C. (EDS.),