

Aminoglicosidi



Inizia a lavorare con il *Mycobacterium tuberculosis* nel 1932.

Scoperta dello *Actinomyces antibioticus* 1940

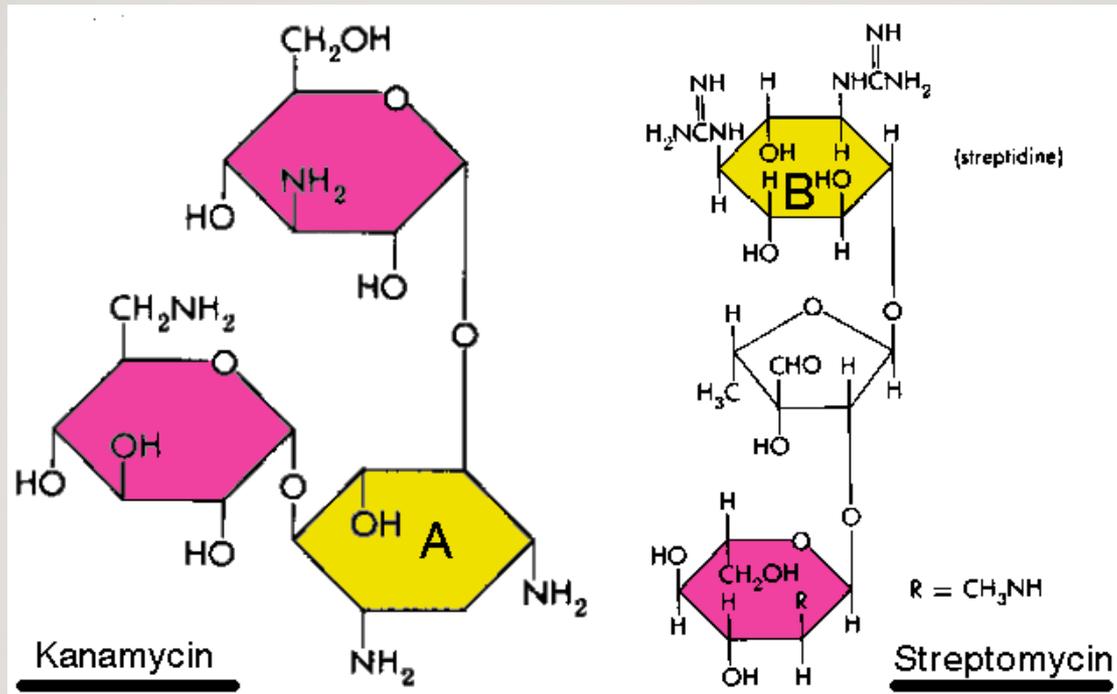
Actinomicina A

Samuel Waksman

1944 da coltura di ceppo di *Streptomyces griseus* isolata la streptomicina

Gli aminoglicosidi rappresentano ancora oggi i farmaci più impiegati in medicina veterinaria per il Trattamento di infezioni di germi aerobi Gram negativi e positivi

Aminoglicosidi



Gli aminoglicosidi sono formati da un gruppo glucosidico legati a gruppi amminici (aminozuccheri)

Si presentano come polveri cristalline idrosolubili, stabili a pH e temperature variabili, peso molecolare tra 300 e 1000D. Molecole polari, basiche, pKa tra 7,2 e 8,8.

Aminoglicosidi

Meccanismo d'azione

Antibiotici battericidi



Penetrazione all'interno della cellula

(Diffusione passiva, trasporto attivo ossigeno dipendente)



Legame con i recettori sulla subunità ribosomiale 30s



Errata produzione di aminoacidi con inibizione della sintesi proteica

1. Interferenza con il sistema di trasporto cellulare degli elettroni
2. Induzione di fenomeni disgregativi a carico dell'RNA
3. Effetti sul metabolismo del DNA
4. Danneggiamento delle membrane cellulari

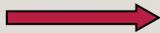
La **streptomicina** agisce su un solo sito, mentre gli altri antibiotici aminoglicosidi agiscono su più siti

- L'effetto battericida si esercita attraverso una anomala formazione dei canali membranari.

Aminoglicosidi

Attività antimicrobica

- Attivi contro batteri **aerobi gram negativi**
- Limitata attività contro i gram positivi
 - Risultano sensibili alcuni **micobatteri** ed alcuni **micoplasmi**
- Inattivi contro batteri anaerobi ed anaerobi facoltativi in condizione di anaerobiosi

L'attività antibatterica degli aminoglicosidi è particolarmente influenzata dal **pH**  maggiore attività in ***ambienti alcalini***

Aminoglicosidi

Fenomeni di resistenza

Tre meccanismi principali:

1. Riduzione della permeabilità della membrana cellulare del microrganismo, attraverso un'alterazione dei componenti della membrana
2. Mancato aggancio alla sub-unità ribosomiale 30S
3. Produzione di svariati enzimi in grado di modificare la struttura dell'aminoglicoside

1. Acetiltransferasi

2. Adeniltransferasi

3. Fosfotransferasi



Aminoglicosidi

Farmacocinetica

- Scarso assorbimento per OS
- Basso legame alle proteine plasmatiche <25%
- Scarsa penetrazione nelle membrane cellulari
- Scarsa diffusibilità (ridotta liposolubilità)
- Ridotti volumi di distribuzione (< 0.35 L/Kg)
- Emivita di 1-2 ore
- Si legano selettivamente al tessuto renale
- Escreto immodificato per via renale

Aminoglicosidi

Tossicità

- Tossicità particolarmente pronunciata nei confronti delle branche dell'ottavo paio di nervi cranici e dei reni; blocco neuromuscolare (più intenso se associato all'uso di miorilassanti) e depressione cardiovascolare.
- **Streptomicina e gentamicina** (branca vestibolare)
- Amikacina, **Kanamicina** e Neomicina (branca cocleare)
- **Tobramicina** (entrambe le branche)
- **Neomicina e Gentamicina** (tossicità renale con necrosi tubulare acuta)

Aminoglicosidi

STREPTOMICINA

Primo antibiotico aminoglicoside ad essere utilizzato nella pratica clinica

Attività antimicrobica

Attiva verso i micobatteri ed alcuni micoplasmi

Verso alcuni batteri gram negativi ed alcuni ceppi di *Staphylococcus aureus*

Farmacocinetica

Somministrato per via parenterale (IM)

Rapido assorbimento

Picco ematico entro 30 minuti



Aminoglicosidi

AMINOGLICOSIDI DIIDROSTREPTAMICI: GRUPPO DELLA NEOMICINA

Neomicina è formata da : Neomicina B e C + frameticina

Molto più attiva della streptomicina e meno attiva della gentamicina, tobramicina ed amikacina

Buona attività nei confronti dello *Staphylococcus aureus*

Scarsa attività nei confronti dei batteri gram positivi

Tossicità!!!!

Scarsamente utilizzato in quanto dotato di alta tossicità

Utilizzato quasi esclusivamente per il trattamento locale delle infezioni



Aminoglicosidi

AMINOGLICOSIDI

DIIDROSTREPTAMICI:

GRUPPO DELLA KANAMICINA

Comprende le **Kanamicine** ed i derivati semisintetici come l'**amikacina**, la **tobramicina** e l'**apramicina** oltre alla **gentamicina**, la **netilmicina** e la **sisomicina**

KANAMICINA

- **Attiva verso diverse specie di micobatteri e micoplasmi**

Tossicità

Meno tossica della neomicina



Aminoglicosidi

AMINOGLICOSIDI DIIDROSTREPTAMICI: GRUPPO DELLA KANAMICINA

Amikacina

- Rappresenta una kanamicina chimicamente modificata
- Maggiore attività rispetto alla Kanamicina
- Elevata resistenza nei confronti di enzimi che inattivano gli aminoglicosidi
- Risultano sensibili le enterobatteriacee, alcuni gram positivi (Nocardia sp. E Staphylococcus aureus)
- Sono resistenti: gli anaerobi, gli Streptococcus e alcuni ceppi di Pseudomonas sp.

Tossicità simile a quella della Kanamicina



Aminoglicosidi

AMINOGLICOSIDI DIIDROSTREPTAMICI: GRUPPO DELLA KANAMICINA

Apramicina

- E' una nebramicina studiata per il trattamento delle enteriti batteriche da gram negativi (suinetti e vitelli)
- Attiva contro lo *Staphylococcus aureus* e molti batteri gram negativi e di alcuni micoplasmi

Aminoglicosidi

GENTAMICINA

Prodotta dalla fermentazione di Micromonospora Purpurea

- Rappresenta il genere più attivo degli aminoglicosidi e quello a più ampio spettro di attività
- Attiva verso molti bacilli gram negativi, gram positivi e numerosi micoplasmi
- Scarsamente efficace nei confronti dei micobatteri
- Inattiva nei confronti dei batteri anaerobi
- Nei vitelli e puledri possiede un elevato volume di distribuzione
- Il principale effetto tossico è rappresentato dalla nefrotossicità (> puledri)

Aminoglicosidi

SPECTINOMICINA

Prodotta dallo Streptomyces spectabilis

- Possiede una scarsa tossicità
- Di uso limitato a causa della rapida insorgenza di resistenze batteriche
- Attività batteriostatica
- Spettro d'attività ampio (sensibili i gram negativi e i micoplasmi, resistenti gli anaerobi)

Aminoglicosidi

Farmaco	Tossicità vestibolare	Tossicità cocleare	Tossicità renale
Streptomicina	+++	++	+
Diidrostreptomicina	++	+++	+
Neomicina	+	+++	+++
Kanamicina	+	++	++
Amikacina	+	+	++
Gentamicina	++	+	++
Tobramicina	+	+	+

Aminoglicosidi

Farmaco	Via di Somministrazione	Specie	Intervallo Somministrazioni (h)	Dose mg/Kg
Amikacina	IM	Cavallo	8-12	4-8
	IM/SC	Cane-gatto	8-12	10
Apramicina	OS	Inf.enter.	12	20-40
	IM	suini	12	20
Gentamicina	IM/IV	Cani gatti	8-12	2-4
Kanamicina	OS	Inf.enter	6	10
	IM/IV	Inf.enter.	8-12	4-8
Neomicina	OS	Inf.enter.	6	10
Spectinomina	OS	Inf.enter	8	20-40
	IM	suini	12	20
Streptomicina	IM	/	8	8-12
Tobramicina	IM/IV	/	8	1-2

Lincosamidi

Lincomicina e Clindamicina



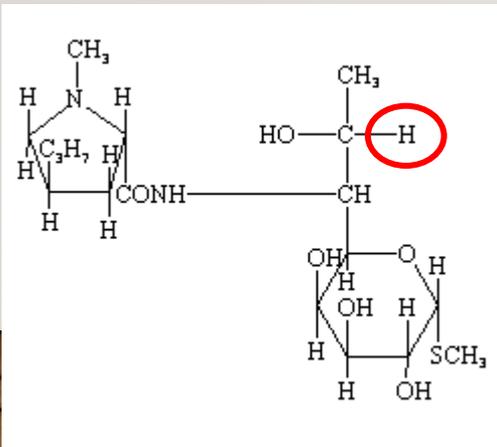
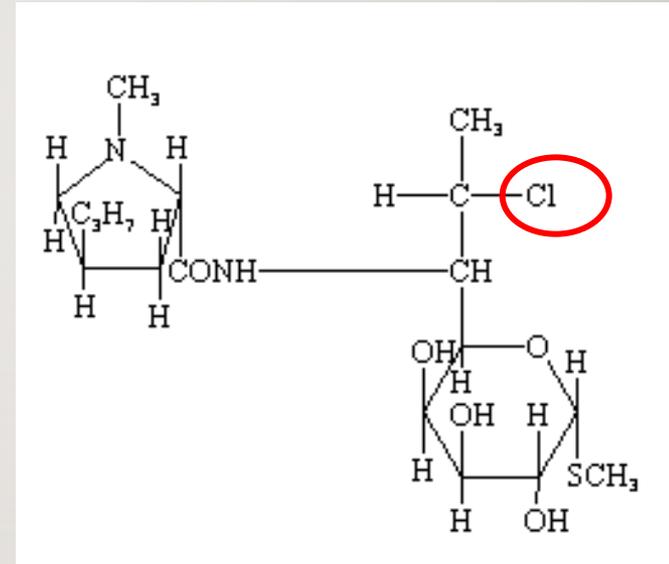
Lincoln



Streptomycin linconensis



Sostituzione di un gruppo idrossilico della lincomicina con un atomo di cloro



Caratteristiche chimiche

1. Composti basici
2. Elevata liposolubilità

Lincosamidi

Lincomicina e Clindamicina

- ➔ Antibiotici ad attività **batteriostatica**
- ➔ Inibiscono la sintesi proteica legandosi alla subunità ribosomiale 50S
- ➔ Inibiscono anche l'enzima peptidil-transferasi

Lincosamidi

Lincomicina e Clindamicina

Spettro di attività antibatterica

- **Particolarmente attivi nei confronti di batteri gram positivi e micoplasmi**
- **Buona attività anche nei confronti dei batteri anaerobi**
- **La maggior parte dei batteri aerobi gram negativi risultano resistenti**

La clindamicina è molte volte più potente della lincomicina

Lincosamidi

Lincomicina e Clindamicina

Resistenza batterica

Si sviluppa molto rapidamente nei confronti della Lincomicina, più lentamente per la clindamicina



Metilazione dei residui di adenina nell'RNA ribosomiale 23S
della subunità ribosomiale 50S

Lincosamidi

Lincomicina e Clindamicina

Farmacocinetica

1. Grande volume apparente di distribuzione
2. Ben assorbite nel tratto gastroenterico
3. Metabolizzazione in sede epatica
4. Circa il 20% viene escreta immodificata nelle urine
5. Passaggio in mammella e prostata
6. LA clindamicina raggiunge concentrazioni efficaci anche a livello osseo

La presenza di cibo riduce significativamente l'assorbimento dei lincosamidi

Dal sito di inoculo IM l'assorbimento è completo

Lincosamidi

Lincomicina e Clindamicina

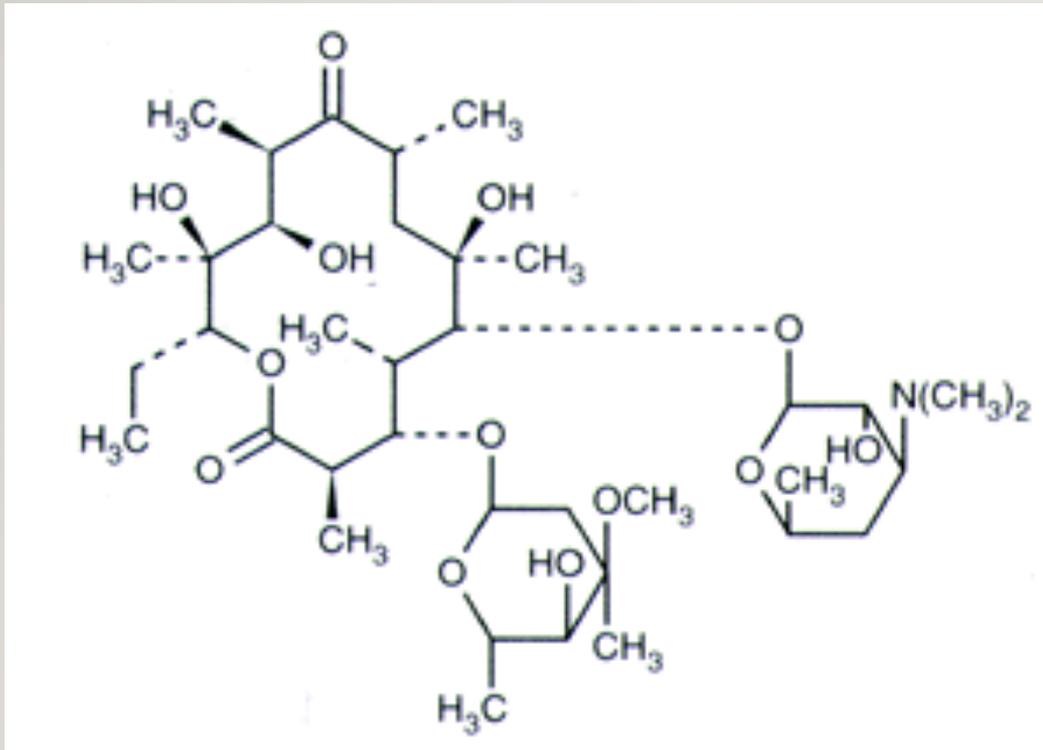
Tossicità

Gravi diarree nell'uomo, nel cavallo, nel coniglio



Sviluppo di ceppi di *Clostridium difficile* resistenti
all'antibiotico

Macrolidi



Eritomicina

Anello lattonico **macrociclico** unito a due o più zuccheri

Eritromicina, Tilosina, Spiramicina, Tilmicosina, Roxitromicina

Macrolidi

Eritromicina

Chimica

L'eritromicina è formata da un anello lattonico macrociclico al quale sono legati due amminozuccheri, ovvero la desosamina e il cladinoso

- Scarsamente solubile in acqua
- Sensibile agli acidi gastrici

Isolata dallo *Streptomyces erithreus*

Meccanismo d'azione

Inibisce la sintesi proteica legandosi alla subunità ribosomiale 50S

- Azione batteriostatica, ad alte concentrazioni può risultare battericida

Macrolidi

Eritromicina

Spettro d'azione

Sensibili gli aerobi gram positivi come: Bacillus sp., Corinebacterium, E. rusopathiae, Listeria sp, Stafilococchi e streptococchi

Sensibili gli aerobi gram negativi come: Actinobacillus sp., Brucella, Campylobacter, Leptospira

Sensibili alcuni anaerobi come: Actinomyces, Bacterioides, Clostridium, Fusobacterium

Meno sensibili: gli enterococchi, Bordetella, Haemophilus, Legionella, Ehrlichia, Pasteurella

Resistenti: Enterobacteriacee, Pseudomonas, Nocardia, Mycoplasma, Mycobacterium

Macrolidi

Eritromicina

Vie di somministrazione

Via orale, IM, IV

Per la somministrazione **ORALE**: sottoforma di base, di stearato, succinato e di estolato

Per la somministrazione **PARENTERALE**: sottoforma di base, glucopentonato e di lattobionato

Macrolidi

Eritromicina

Farmacocinetica

- Prontamente assorbita dal tratto gastroenterico e dal sito di inoculo
- Buona distribuzione nei tessuti (polmoni, fegato, reni, liquido peritoneale, pleurico, feto) ad eccezione del cervello e del liquido cefalorachidiano.
- Emivita 8-9 ore (nel cavallo 1-2 ore)
- Eliminazione con bile e feci (piccole quantità con le urine)

Macrolidi

Eritromicina

Resistenza

- Meno comune quella cromosomica
- Più frequente quella plasmidica → Metilazione del sito di aggancio alla subunità ribosomiale.

Macrolidi

Tossicità

Antibiotico tra i più sicuri

Problemi comuni a tutti i macrolidi:

Sostanze irritanti



- Flebiti
- Dolore
- Reazioni cellulari

Disturbi gastrointestinali, per
stimolazione della
muscolatura liscia



Generalmente poco gravi

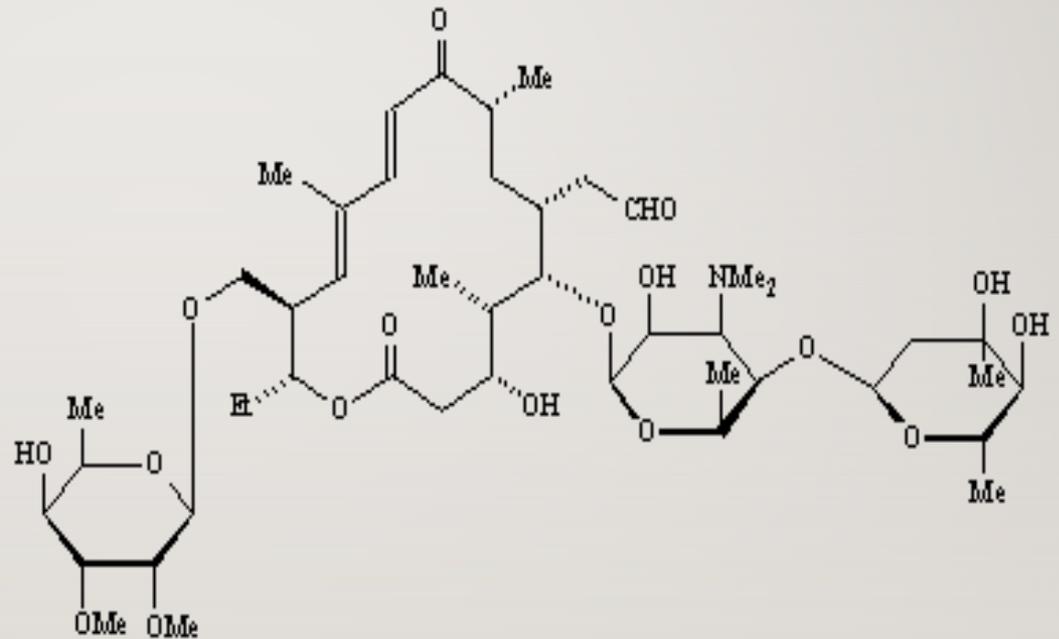
Cavallo!!!

Macrolidi

Tilosina

Isolata dallo Streptomyces fradiae

Spettro d'azione simile
a quello della
eritromicina, meno
attiva nei confronti dei
batteri, ma più attiva
nei confronti dei
micoplasmi

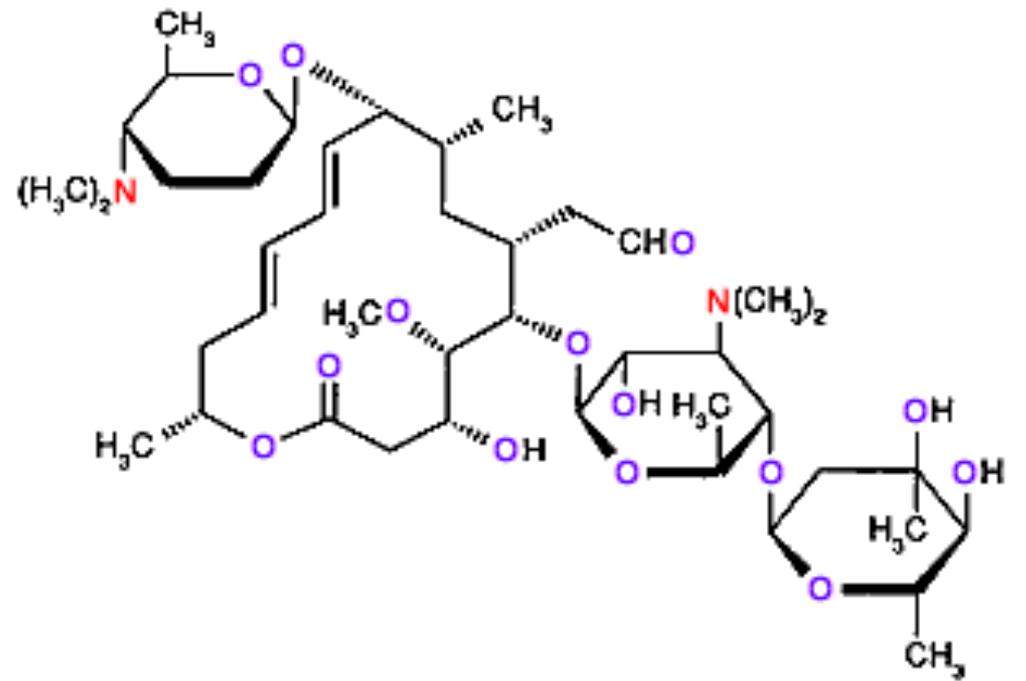


Macrolidi

Tilosina

- Utilizzata essenzialmente per OS (Tilosina tartrato), ma anche per IM (Tilosina fosfato)
- Elevata liposolubilità
- Buon assorbimento
- Emivita 1 ora
- Escrezione biliare ed urinaria

Macrolidi



Spiramicina

Spettro d'azione simile a quello degli altri macrolidi, ma con minore efficacia nei confronti dei micoplasmi

Notevole capacità di concentrarsi nei tessuti



Notevole efficacia nei confronti dei parassiti intracellulari

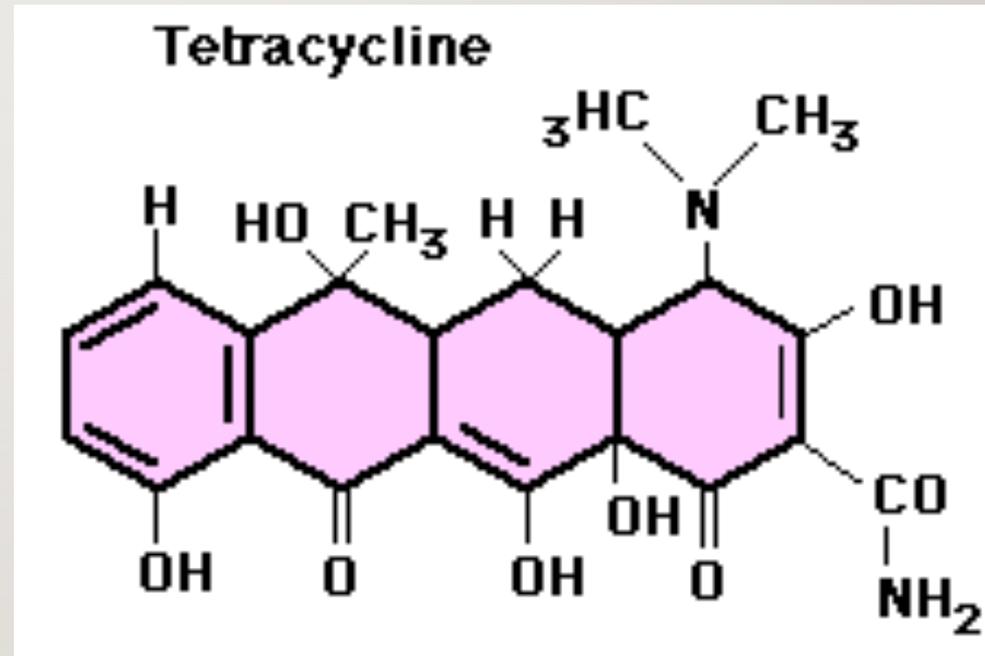
Farmaco	Dose mg/Kg	Via di somministrazione	Intervallo (h)	Impiego
Eritromicina	10-20	OS	8	No erbivori
Estolato	25	OS	6	Polm. Pul.
Eritromicina	5	IV	6	-
Eritromicina	3-5	IM-IV	8-12	IV solo cavalli
Lattobionato				
Tilosina	20-30	IM	8-12	No cavalli Si suini
Tilmicosima	10	SC	72	Solo bovini
Spiramicina	20	IM	24	bovini

Tetraciclina

Clortetraciclina, Ossitetraciclina, Tetraciclina, Doxicillina, Minociclina

Sostanze cristalline,
debolmenti solubili in acqua

Utilizzate essenzialmente
sottoforma di sali cloridrati



Forme farmaceutiche: Capsule, compresse, boli, integratori
medicati e pomate – forme per la somministrazione parenterale

Tetraciclina

naturali: **OSSITETRACICLINA**
CLORTETRACICLINA

semisintetiche: **TETRACICLINA**
DOXICICLINA

Tetracicline

Meccanismo d'azione

Sono antibiotici batteriostatici

Agiscono inibendo la sintesi delle proteine batteriche andando a legarsi alla porzione ribosomiale 30S



Impediscono il legame dell'RNA aminoacil-transferasi sul complesso ribosoma-RNA messaggero

Sono considerati antibiotici ad ampio spettro d'azione

Tetraciclina

Spettro d'azione

Risultano sensibili: Aerobi gram positivi, micoplasmi, Clamidio, **rickettsie ed alcuni protozoi**

Resistenza batterica

Fenomeno diffuso che sta limitando l'utilizzo di questo antibiotico

Resistenza plasmidio mediata (interferenza con i meccanismi che portano le tetraciclina all'interno della cellula)

Tetraciclina

Farmacocinetica

Nel cane e nel gatto le tetraciclina vengono rapidamente assorbite nel tratto gastrointestinale

Negli erbivori possono essere somministrate per via parenterale, orale(?) e topica

Ad eccezione della Minociclina e della Doxamiciclina, l'assorbimento è limitato dalla presenza di cibo (latte e derivati) → chelati da ioni bivalenti

L'assorbimento è elevato e varia in base alla liposolubilità dei composti > minociclina e doxiciclina (superano la barriera ematoencefalica)

Minociclina e la doxiciclina > legame alle proteine plasmatiche

Vengono eliminate immutate attraverso l'urina e in misura minore con la bile (circolo enteroepatico)

Tetracicline

Farmacocinetica

Nelle somministrazioni per OS l'emivita è di 6-8 ore

La Minociclina e la Doxiciclina vengono eliminati prevalentemente attraverso le feci (non prevede filtrazione renale)

Tetracicline

Tossicità

1. superinfezioni da funghi, lieviti e batteri resistenti
2. diarree mortali per enterite: nel cavallo (colite X)
3. blocco attività della flora microflora ruminale
4. ipo-avitaminosi K e B
5. inibizione della calcificazione
6. colorazione bruna dei denti (e ossa)
7. ipotensione se somministrata per via i.v. rapida (chelazione del Ca)

Tetracicline

Tossicità

1. iperazotemia da accentuazione del catabolismo proteico
2. nefrotossicità.
3. istolesività per somministrazione parenterale

Tetracicline

Specie	Formulazione	Vie somministrazione	Dose	Intervallo	Osservazioni
Cane, gatto	Tetraciclina,	IV-IM	10	12	-
	Ossitetraciclina	IV-IM	10	12	-
	Doxiciclina	IV	5-10	12	-
Cavalli	Ossitetraciclina	IV	3-5	12	-
Ruminanti	Tetraciclina	IV-IM	10	12-24	IV lenta
	Ossitetraciclina	IV-IM	10	12-24	IV lenta
	Tetraciclina long-acting	IM	20	48	-
Suini	Clortetraciclina	OS	10-30	24	-

CHINOLONI

acido nalidixico

acido pipemidico

fluorochinoloni

ENROFLOXACIN

NORFLOXACIN

RUFLOXACIN

BATTERICIDI

per inibizione della

DNA-girasi batterica

SPETTRO ANTIBATTERICO

- Salmonelle, Shighelle, Campylobacter, Yersinia enterocol., E.Coli,
- Chinoloni IIIa generaz.: (Gram + e -): Clamidio, Micoplasmi, germi multiresistenti

FARMACOCINETICA:

- **assorbimento:** buono per via orale
- emivita : compresa tra 4 e 10 ore
- in parte metabolizzato
- **escrezione:** fegato 70 % e rene 30 %
- **effetti collaterali:**
 - artropatie negli animali giovani
 - controllare funzionalità epatorenale

FARMACOCINETICA:

Si distribuiscono in:

Liquido cefalo-rachidiano

Secrezioni bronchiali

Tessuto osseo

Cartilagini

Tessuto prostatico

Elevate concentrazioni negli organi emuntori (fegato, bile e vie urinarie). Circolo enteroepatico



DOSAGGIO

**Cani, gatti: 5 mg/Kg os, i.m. ev
(diluita) 12/24h**

**bovini, suini, ovi-caprini, conigli 2.5-5 mg/Kg
im, iv 24h**

volatili e conigli 5-10 mg/Kg os (H₂O) 24h

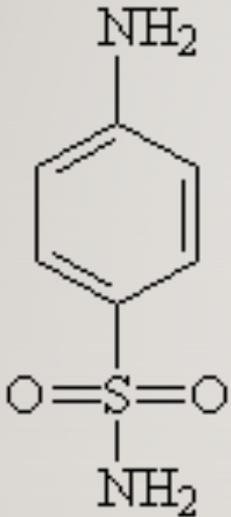
Sulfamidici

Storia

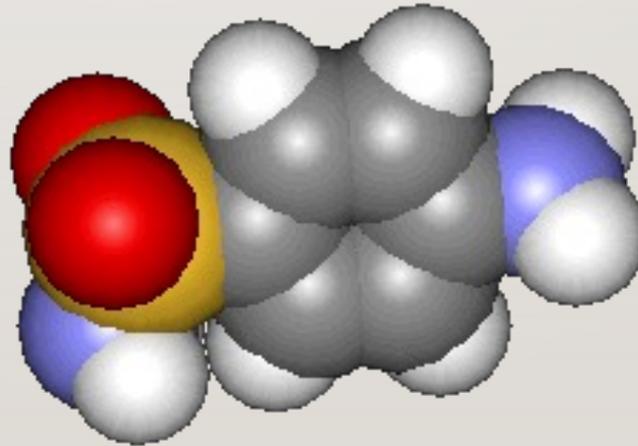
1935 scoperta dell'attività antibatterica del Prontosil (colorante azoico) contenente il gruppo para-aminobenzensulfonamidico

(Mietzsch, Klarer e Domagk)

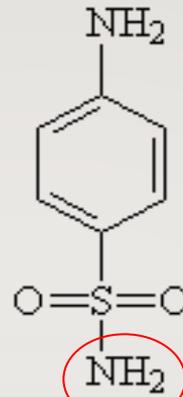
Derivano tutti dalla Sulfanilamide differendo tra loro solo nel radicale R:



Sulfanilamide

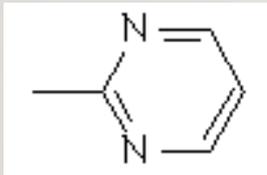


Sulfamidici

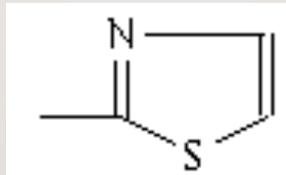


R

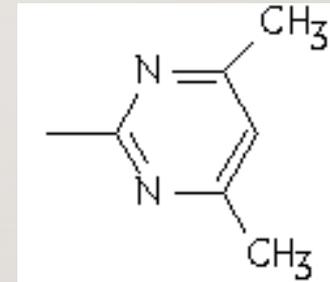
Sulfanilamide



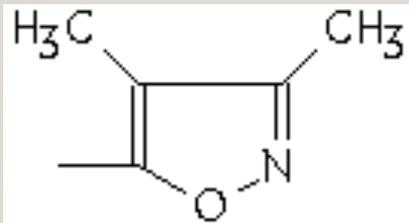
Sulfadiazina



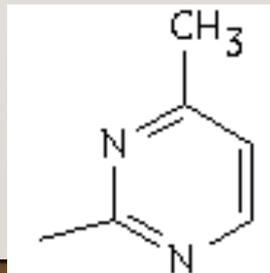
Sulfatiazolo



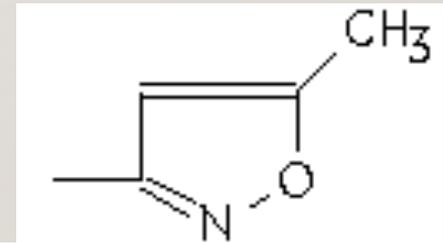
Sulfadimidina



Sulfisoxazolo



Sulfamerazina



Sulfametossazolo

Sulfamidici

Polveri bianche cristalline quasi insolubili in ambiente neutro ed aumentano la loro solubilità in ambiente alcalino ed in quello acido

Nelle preparazioni contenenti più sulfamidici ciascun sulfamidico esibisce la propria solubilità!!!!!!!!!!

Preparazioni:

I **Sali sodici** possiedono maggiore solubilità in acqua → **I.V.**

Altamente alcaline (sulfacetamide sodica → **neutra**)

Formulazioni a lento assorbimento → **infezioni enteriche**

Sulfamidici

Meccanismo d'azione

Interferiscono con la sintesi dell'acido folico nelle cellule batteriche, prevenendo in modo competitivo l'incorporazione dell'acido para-aminobenzoico (PABA) nella molecola dell'acido folico

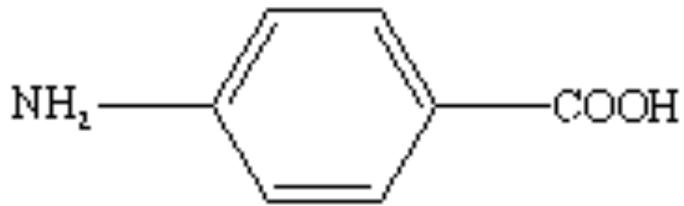
Competono con il PABA nei confronti dell'enzima **diidropteroato sintetasi**

L'acido tetraidrofolico interviene nella sintesi delle basi puriniche e pirimidiniche

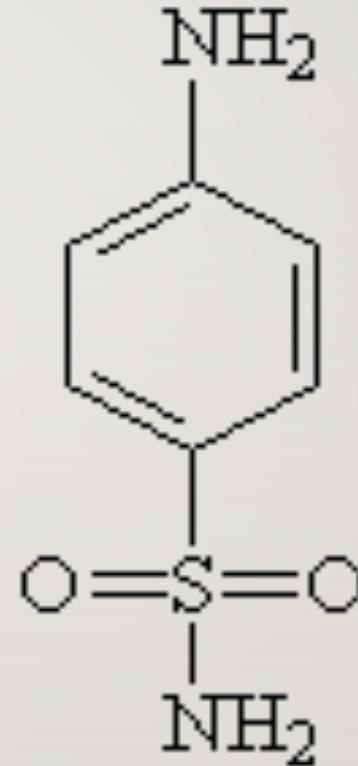
- Le **cellule dei mammiferi** utilizzano acido folico preformato
- I **batteri** possono utilizzare solo acido folico da essi sintetizzato



Sulfamidici



Acido paraminobenzoico



Sulfanilamide

Sulfamidici

Attività antimicrobica

Farmaci antimicrobici ad **ampio spettro** con attività **batteriostatica**

Attivi nei confronti di batteri, clamidie, toxoplasmi, ed alcuni protozoi (coccidi)

Risultano sensibili: Actinomyces sp., Bacillus sp., Brucella sp., E. rhusiopathie, L. monocytogenes, Streptococcus sp., Chlamydia sp., Coccidi.

Risultano resistenti: Mycobacterium sp., Mycoplasma sp., Rickettsia sp., P. aeruginosa e le spirochete.



Sulfamidici

Resistenza

Resistenza cromosomica: lenta, si sviluppa nel tempo ed è caratterizzata da una minore capacità del farmaco di penetrare la membrana, dalla produzione di un enzima diidropteroato sintetasi insensibile o da una superproduzione di PABA

Resistenza acquisita: molto più comune determina scarsa possibilità di penetrazione della cellula da parte del farmaco o produzione di enzimi sulfamido-resistenti

Sulfamidici

Farmacocinetica

Assorbimento:

1. Le vie di somministrazione possono essere SC, IM, IV, OS, IP, applicazioni topiche
2. PK_a varia da 4.79 a 8.56 → acidi organici deboli
3. Influenzato dalla ionizzazione e lipofilia del farmaco
4. Per le somministrazioni per OS: assorbimento maggiore nel maiale piuttosto che nell'ovino e bovino

Sulfamidici

Farmacocinetica

Vie di somministrazione:

OS:

Boli, soluzioni, integratori, polveri ecc.

Sulfamidici in acqua

Conseguimento e mantenimento di concentrazioni di farmaco efficaci, per tempi più lunghi rispetto alla stessa dose somministrata per IV.

Concentrazioneinferiore ?

Danni alla microflora intestinale (ruminanti e cavallo)

Sulfamidici

Farmacocinetica

Vie di somministrazione:

IV: Utilizzata nelle infezioni acute

Rischio di tossicità renale

Da preferire molecole a lunga emivita

IM:

Istolesività

Solo soluzioni tamponate

Rapido assorbimento

Sulfamidici

Farmacocinetica

vie di somministrazione:

Intrauterina:

Pessari o soluzioni addizionati con urea

Topica:

Da evitare (Pus, essudati, ecc.)

Sulfamidici

Farmacocinetica

Distribuzione:

1. Rapida distribuzione nel torrente circolatorio (5-15 mg/ 100 mL)
2. Il passaggio nei tessuti è condizionato da:
3. Stato di ionizzazione
4. Vascolarizzazione del tessuto
5. Presenza di barriere
6. Quota legata alle proteine (15-90%)

Sulfamidici

Farmaco	pK _a	Percentuale non ionizzata	Emivita (min)	Vd (L/Kg)	Legame alle Proteine plasmatiche (%)
Sulfanilamide	10.4	100	370	1.08	< 20
Sulfametazina	7.4	50	680	0.44	70
Sulfadiazina	6.4	9	150	0.75	14
Sulfadossina	6.1	4.8	650	0.37	48-66
Sulfametossazolo	6.0	3.8	140	0.30	62
Sulfadimetossina	6.0	3.8	750	0.31	80-85

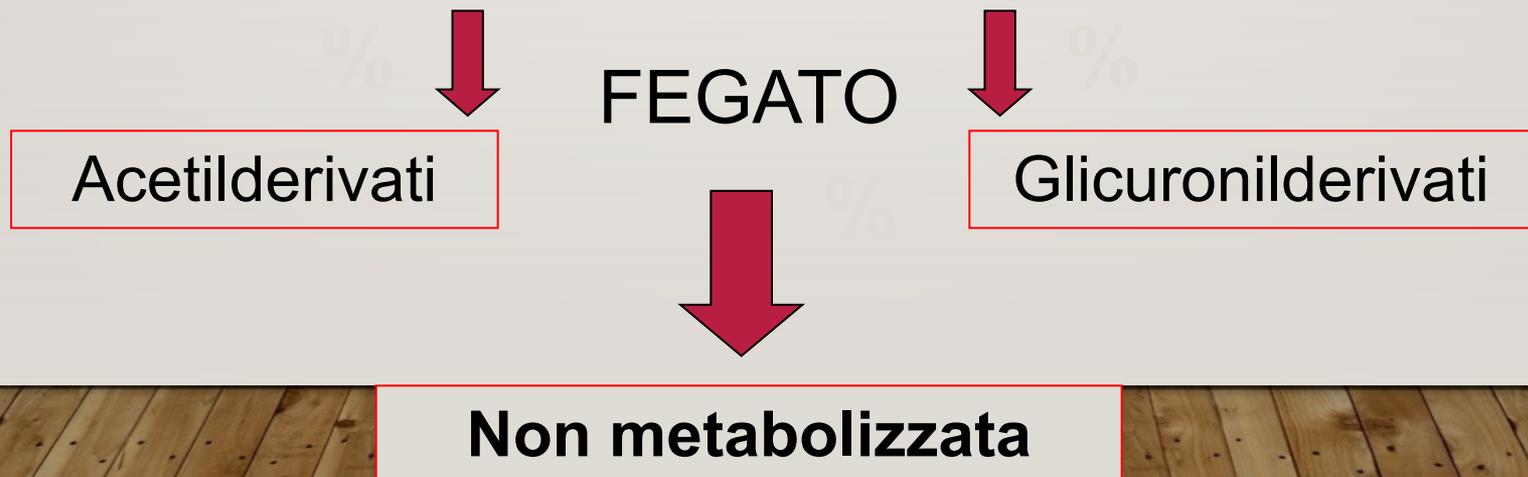
Cinetica di alcuni sulfamidici nella bovina

Sulfamidici

Farmacocinetica

Metabolizzazione:

Largamente metabolizzati nell'organismo attraverso reazioni di acetilazione, deacetilazione, ossidazione, coniugazione con solfati od acido glicuronico, deaminazione con apertura degli anelli



Sulfamidici

Farmacocinetica

Metabolizzazione:

La metabolizzazione dà origine a **composti meno attivi**, inoltre, l'acetilazione riduce la solubilità delle molecole aumentando il rischio di **tossicità renale**, al contrario quelli legati ai solfati ed all'acido glicuronico risultano più solubili

Tossicità

Danno renale ed a carico delle vie urinarie

Cristalluria, ematuria, ostruzione tubulare (urine acide)

-associazione di più sulfamidici-

Legge della solubilità indipendente

Sulfamidici

Associazioni:

La riduzione dell'acido diidrofolico ad acido tetraidrofolico, è catalizzata dall'enzima diidrofoloreduttasi (**DIFR**)

Esistono dei derivati 2,4-diaminopirimidinici (**DAP**) con rilevante affinità per il **DIFR** capaci di inibirne l'azione con conseguente riduzione della produzione di **timina**

Trimetoprim ed Ormetoprim

Diaminopirimidina

Base debole con pK_a di 7.6

Scarsamente solubile

Si lega per il 60% alle proteine plasmatiche

Buona distribuzione nei tessuti

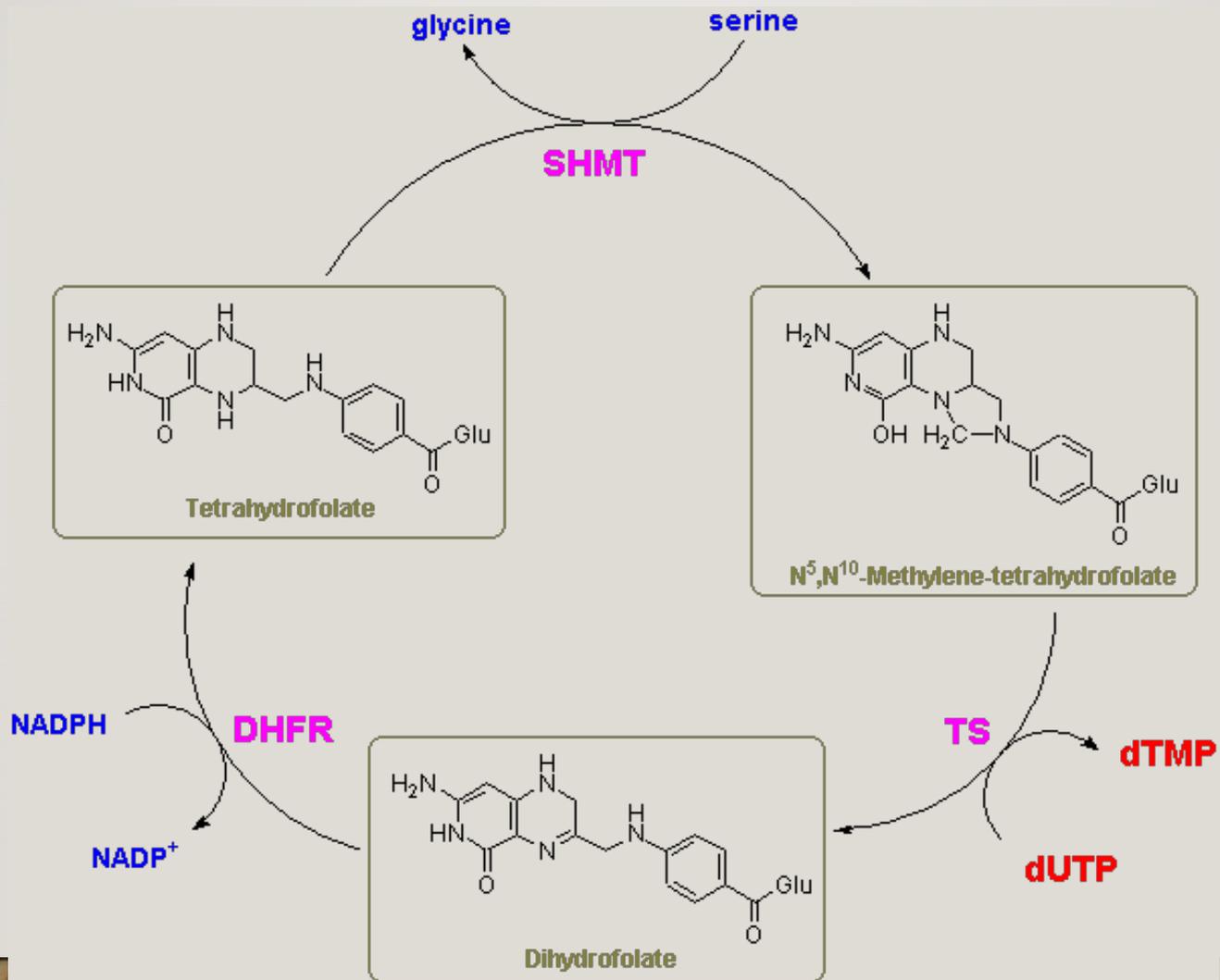
Metabolizzato a livello epatico

Privo di tossicità

Attivo contro: aerobi Gram+ e Gram-

Inattivo contro: anaerobi

Sulfamidici



Sulfamidici

Farmaco	Via di somministrazione	Dose Mg/Kg	Intervallo (h)
A breve azione Sulfadiazina	IV, OS	50-60	12
Ad azione intermedia Sulfadimetossina	IV,SC	27.5	12-24
Sulfadimetossina	OS	55	12-24
Sulfisossazolo	OS	50	8
Sulfametossazolo	OS	50	12

Meccanismo d'azione dei varie classi antimicrobiche

Sintesi della parete batterica

- B-lattamici

Penicilline
Cefalosporine

RNA polimerasi

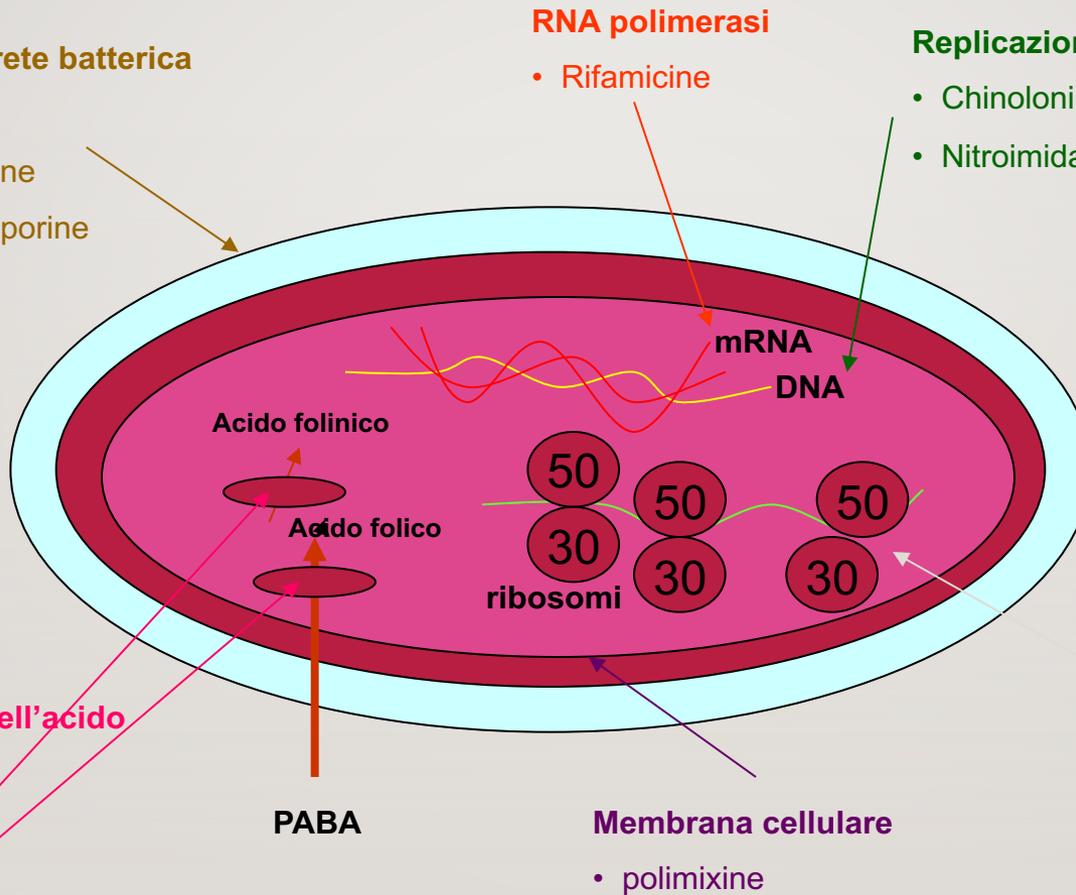
- Rifamicine

Replicazione del DNA

- Chinoloni
- Nitroimidazoli

Metabolismo dell'acido folico

- Trimetoprim
- Sulfamidici



Sintesi della
Antibiotici
antibiotici