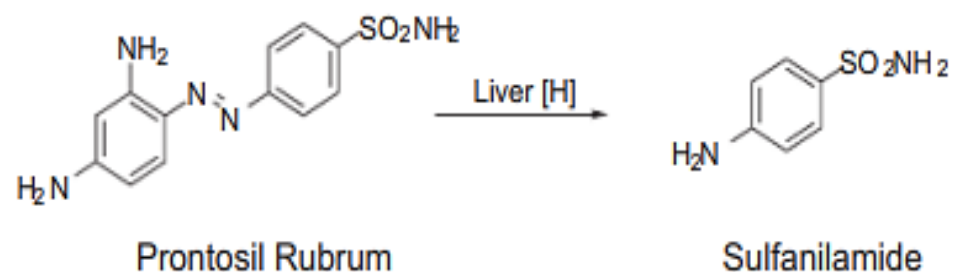


بسمه تعالی سولفونامید ها

تهیه و تنظیم: امیرمهدی ایمان زاده
دکتر داروساز، دانشجوی دکتری تخصصی فارماسیوتیکس علوم پزشکی تبریز

تاریخچه

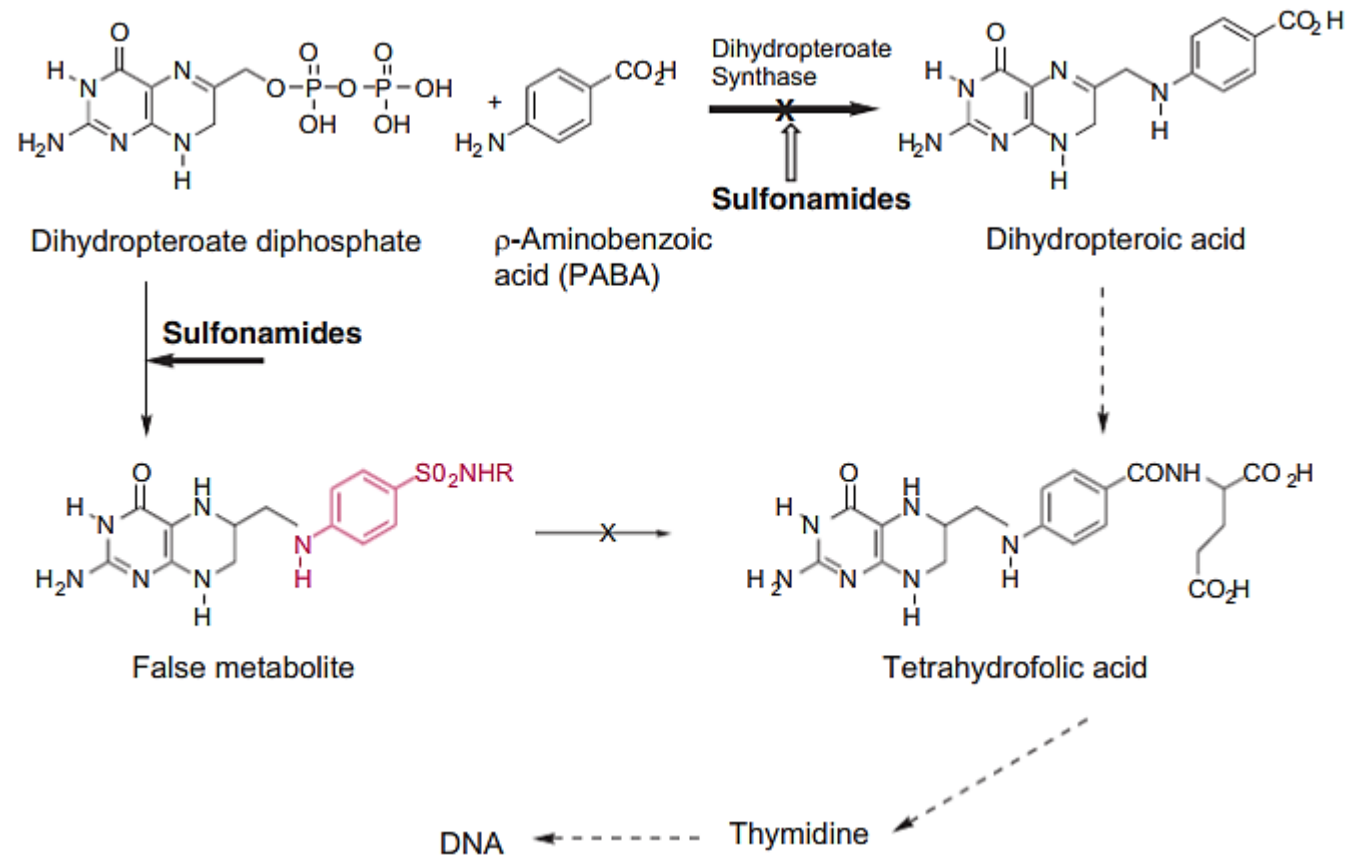


پرونتوسیل روبروم = پرودراگ

در کبد تبدیل به ماده فعال

مکانیسم: مهار دی هیدروپتروات سنتاز

مکانیسم عملکرد سولفونامید ها



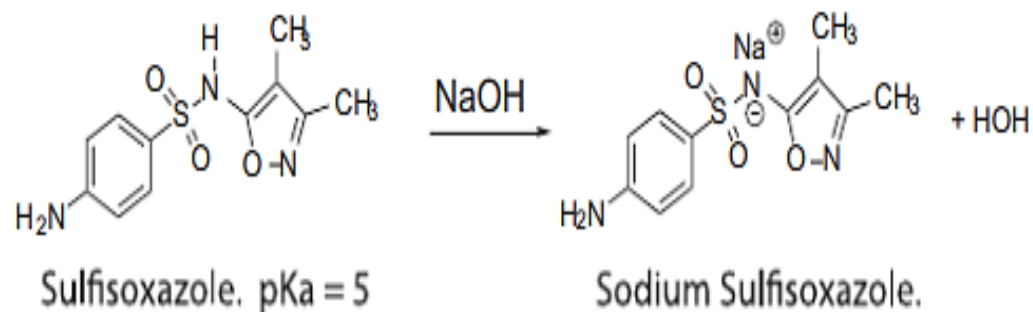
روابط ساختمان - فعالیت

شبهت به PABA

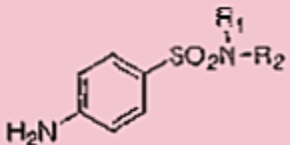
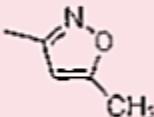
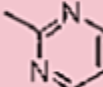
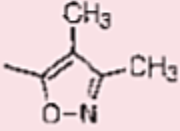
هرچه الکترون کشنده تر --> ترکیب قوی تر

هرچه الکترون کشنده تر --> اسیدی تر

هرچه الکترون کشنده تر --> کریستالوری کمتر



اعضای سولفونامید ها

TABLE 33.1 Clinically Relevant Sulfonamides				
Generic Name				pKa
	R ₁	R ₂		
Sulfamethoxazole	H			5.6
Silver Sulfadiazine	Ag ⁺			
Sulfisoxazole	H			5.0
Sulfacetamide	H	COCH ₃		5.4

نکات فارما کو کینتیکی

قابلیت مصرف خوراکی و توزیع مناسب در بدن

دفع بصورت کلیوی و امکان ایجاد کریستالوری (مخصوصا در نسل قدیم)

پروتین بایندینگ بالا --> تداخل با بیلی روبین و داروهای دیگر --> یرقان نوزادی

راه های ایجاد مقاومت --> افزایش پابا، کاهش حساسیت آنزیم و پلاسمید

غیرفعال شدن با استیلآسیون در نیتروژن شماره ۴ و گلوکوروئیدآسیون

اندیکاسیون

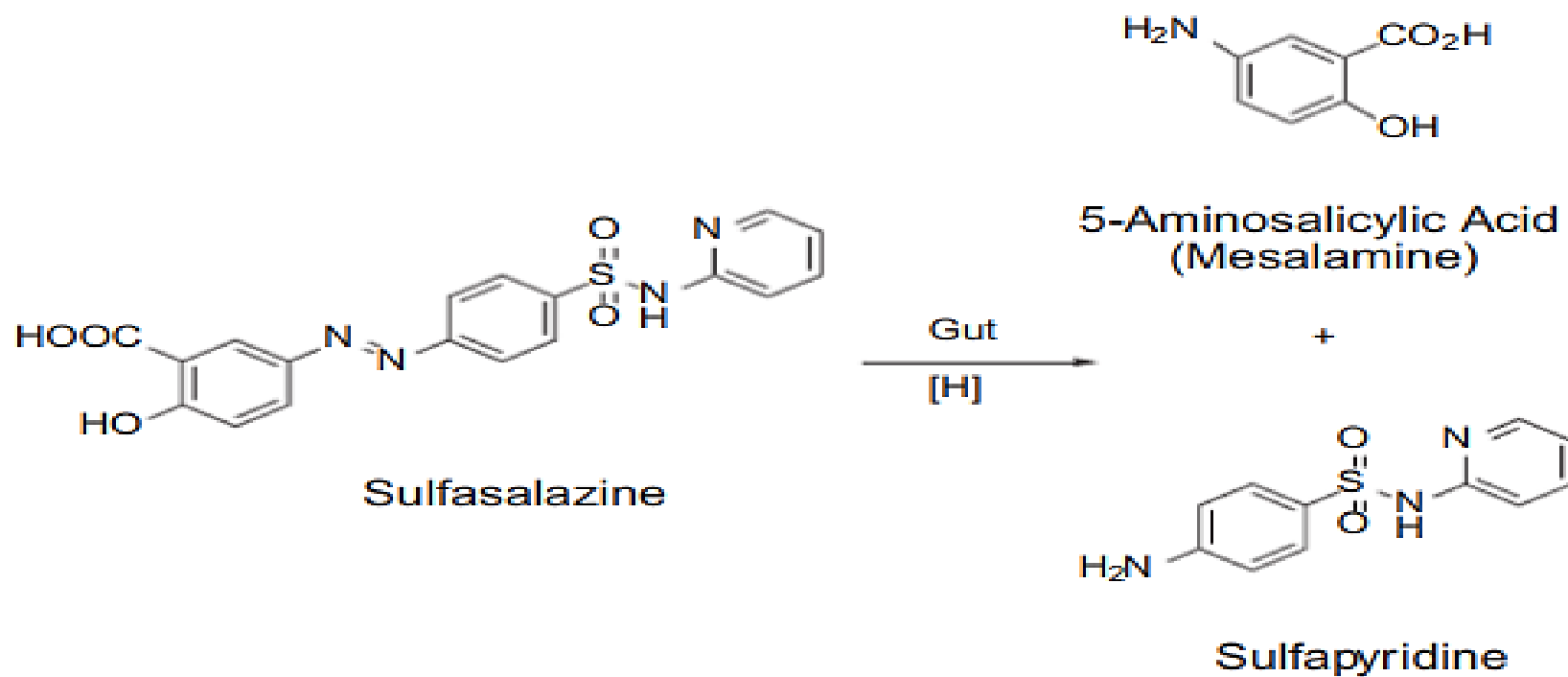
به دلیل مقاومت بالای باکتری ها -- مصرف محدود / سولفاستامید -- قطره چشمی

اثر روی گرم منفی ها بیشتر مثل انتروباکتریاسه، استرپتوکوک پنومونیه و پیوژنز و هموفیلوس

سولفادiazین -- فقط مصرف موضعی و در سوختگی و باکتری / قارچ ها

سولفاسالازین (پرودراگ) -- سولفاپیریدین + مزالامین (۵-آمینوسالیسیلات) -- بیماری کرون

فعال شدن سولفاسالازین



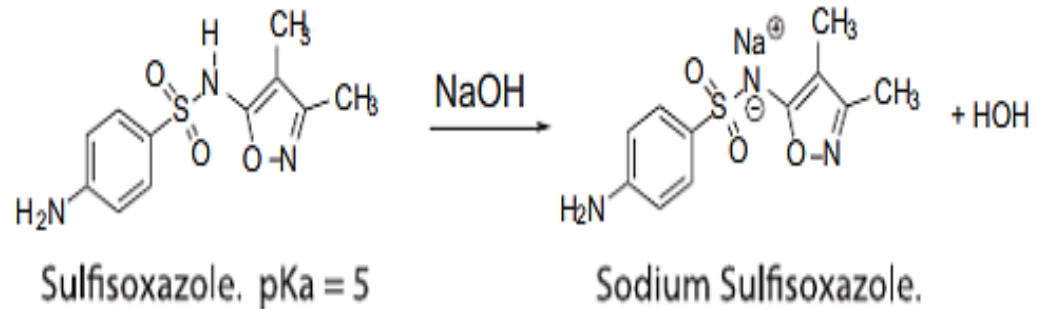
عوارض مهم

استیون جانسون (بسیار خطرناک)

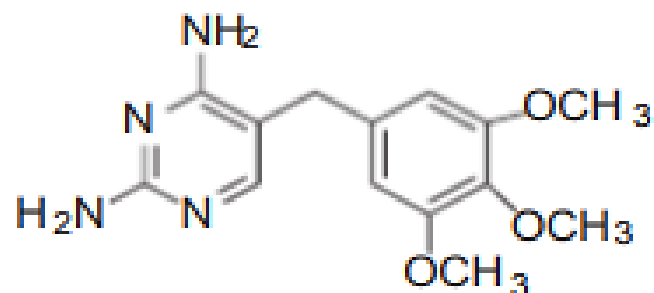
آنمی همولیتیک --> مشابه دیگر ادراری ها

واکنش های آلرژیک و راش

حساسیت به نور



تری متوپریم



Trimethoprim (Proloprim, Trimplex)

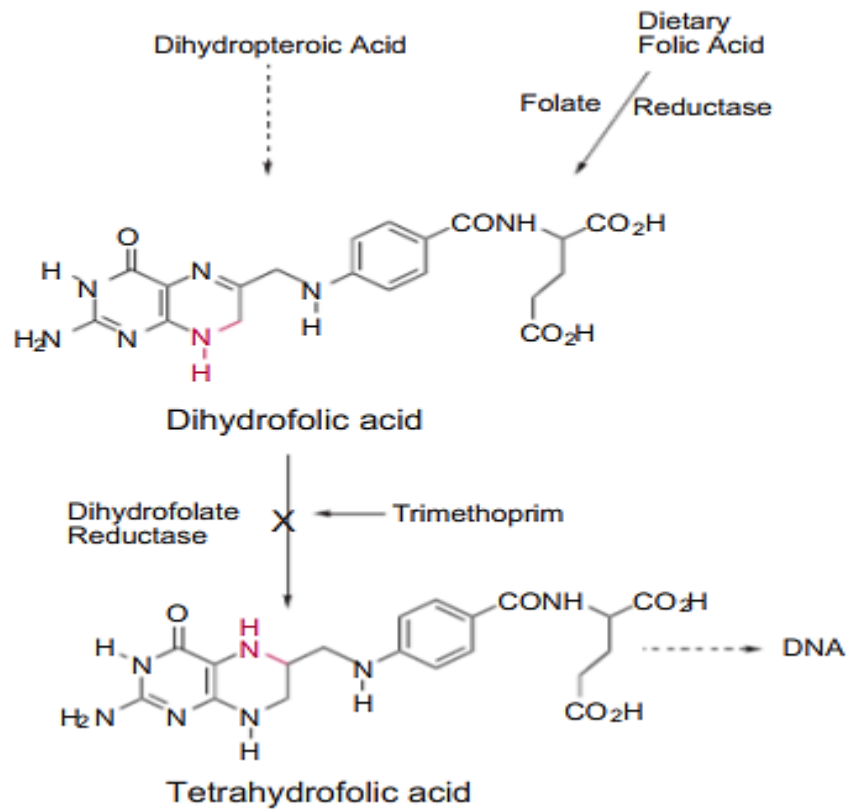
تری متوپریم یعنی تری (سه تا) متوکسی

مهارکننده دی هیدرو فولات ردوکتاز باکتری

بسیار اختصاصی آنزیم باکتری

همانند سولفونامید ها، باکتریواستاتیک

تری متوپریم



در ترکیب با سولفامتوکسازول --> کوتریموکسازول

کاربرد --> عفونت ادراری و گوارشی و تنفسی

مهار دو آنزیم بصورت همزمان

همانند سولفونامید ها، باکتریواستاتیک