

آنتی بیوتیک های مهار کننده بیوسنتز پروتئین

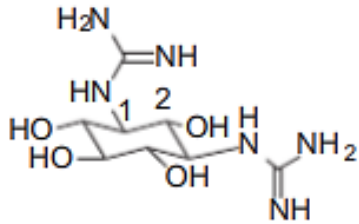
بسمه تعالی

آمینو گلیکوزید و آمینو ساینکلیتول ها

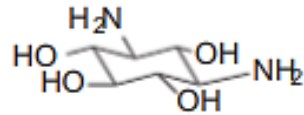
تهیه و تنظیم: امیرمهدی ایمان زاده

دکتر داروساز، دانشجوی دکتری تخصصی فارماسیوتیکس علوم پزشکی تبریز

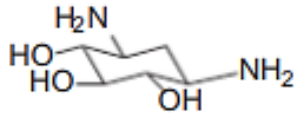
تاریخچه



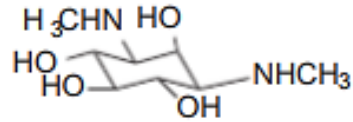
N¹,N³-bis(aminoimino-methyl)streptamine



Streptamine



2-Deoxystreptamine



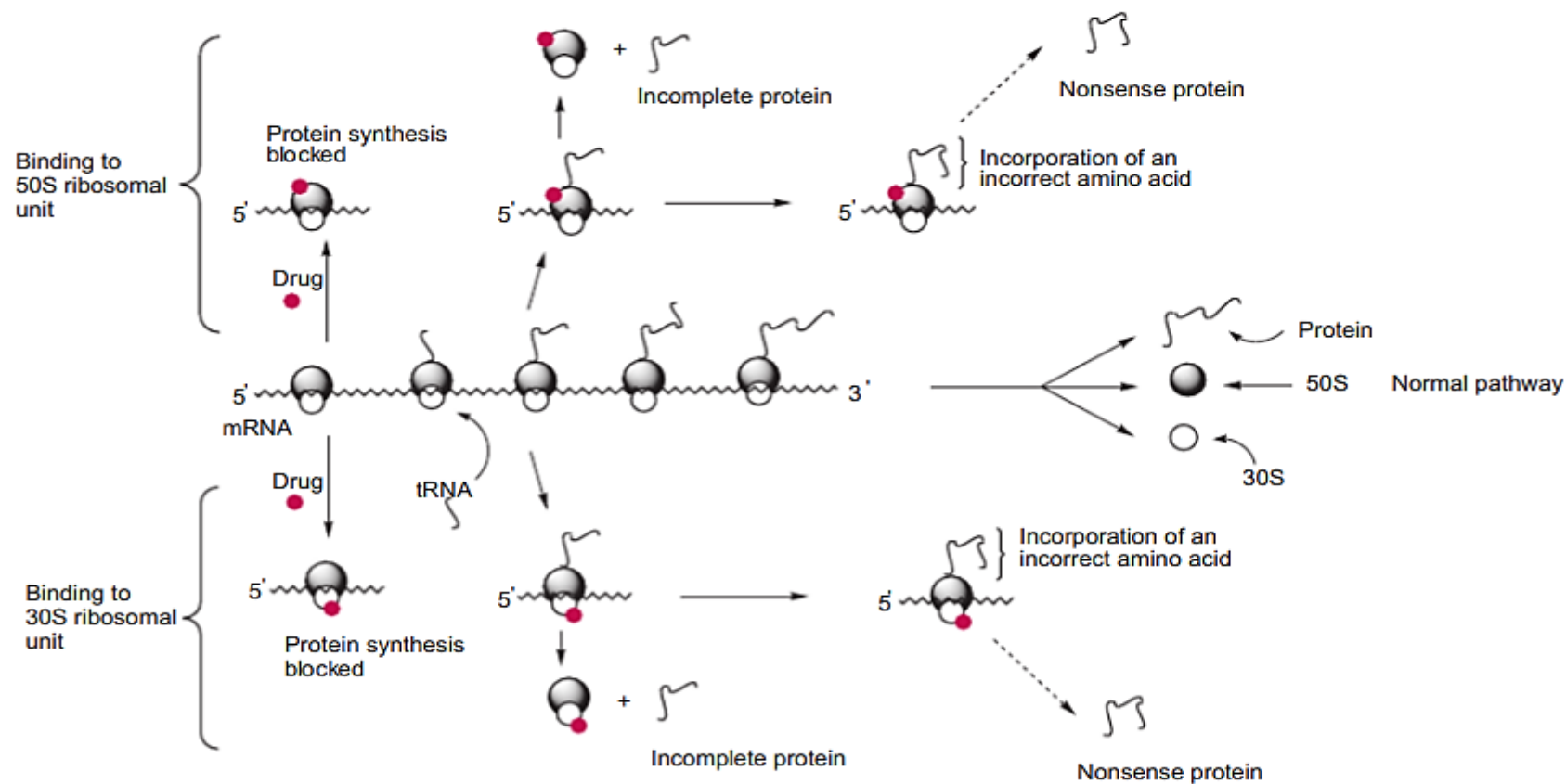
Spectinamine

فارماکوفور--> ۱ و ۳-دی-آمینواینوزیتول

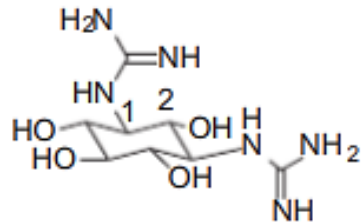
آمینو گلیکوزیدها--> شبیه الیگوساکاریدها

مکانیسم: مهار زیر واحد 30S (Buy AT 30)

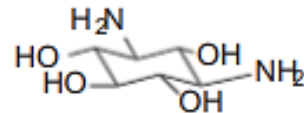
مکانیسم عملکرد آنتی بیوتیک های مهار کننده سنتز پروتئین



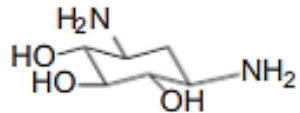
نکات اولیه آمینو گلیکوزید ها



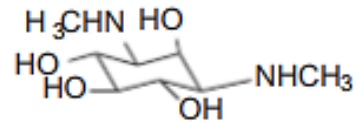
N¹,N³-bis(aminoimino-methyl)streptamine



Streptamine



2-Deoxystreptamine



Spectinamine

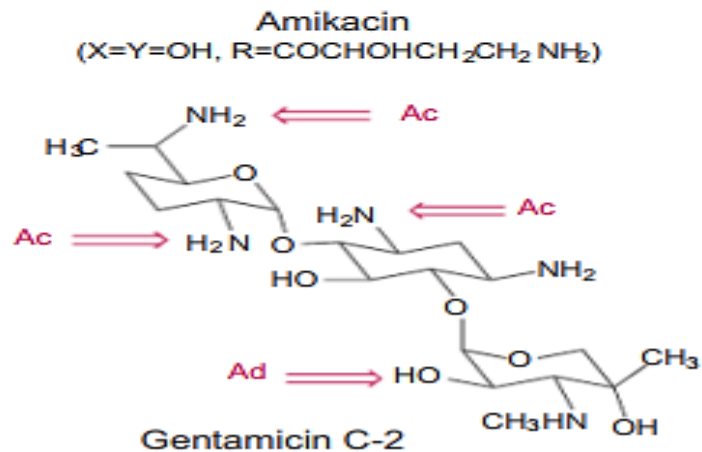
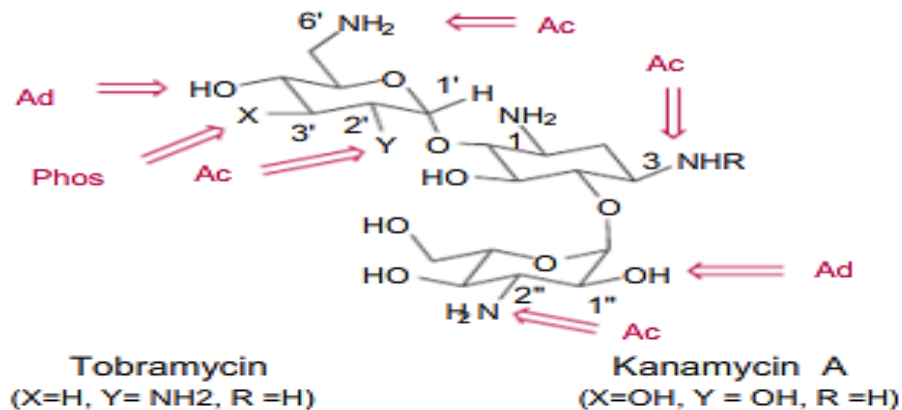
اثر بیشتر روی گرم منفی ها

به دلیل هیدروکسیل بالا --> بسیار هیدروفیل

راه استفاده --> وریدی بیشتر، کمتر خوراکی، موضعی (پوست و چشم)، عضلانی و استنشاقی

خودشان بازی --> نمک هایشان اسیدی

مروری بر مکانیسم و مقاومت



مهار ساخت پروتین های مهم (مثلا غشا) --> به هم خوردن انسجام غشا --> باکتری سیدال

آنزیم های مهم در ایجاد مقاومت به این داروها:

استیلاز، فسفریلاز، نوکلئوتید ترانسفراز

کاهش ورود آنتی بیوتیک به باکتری (متد دیگر)

اندیکاسیون

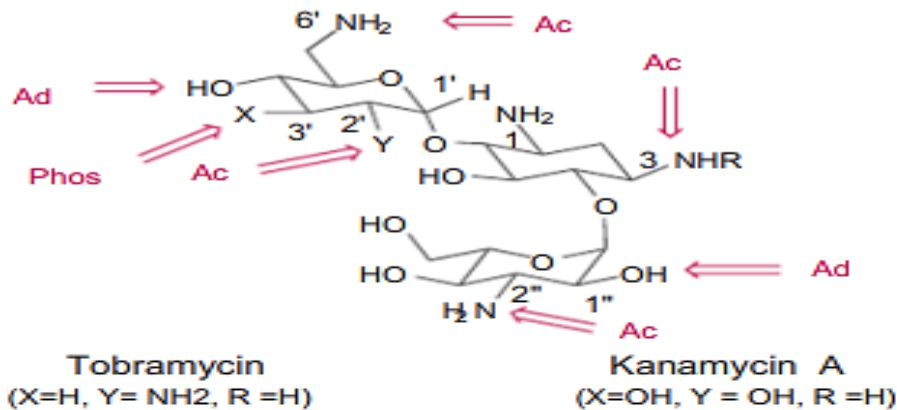
بیشتر خط آخر و گرم منفی های مقاوم مثل سیتروباکتر، آسینتوباکتر، انتروباکتر، شیگلا و ..

موثر روی گرم مثبت های هوازی مثل استاف اپیدرمیدیس

استرپتومایسین بیشتر در توبرکلوزیس و بروسلوز / اسپکتینومایسین در سوزاک

پارومومایسین در آمیبیازیس روده

عوارض مهم

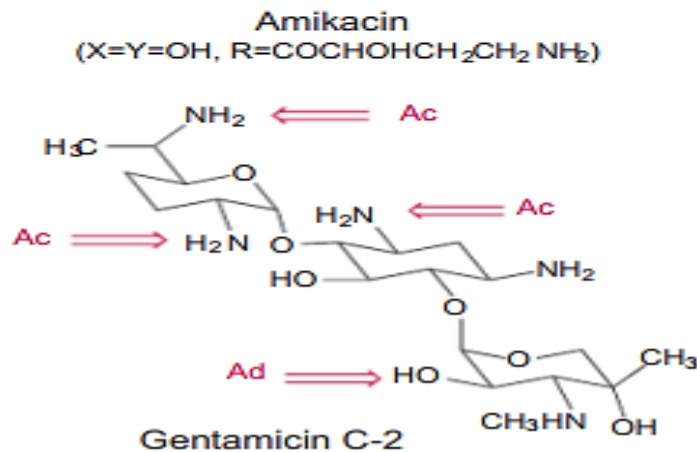


عارضه مهم کاهش شنوایی (اتوتوکسیسته)

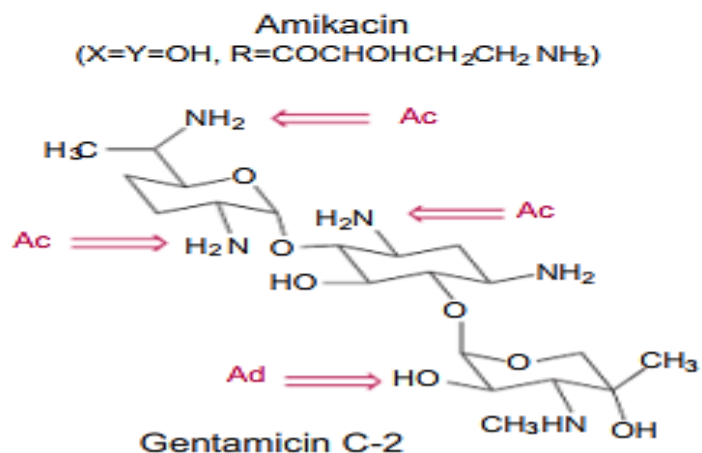
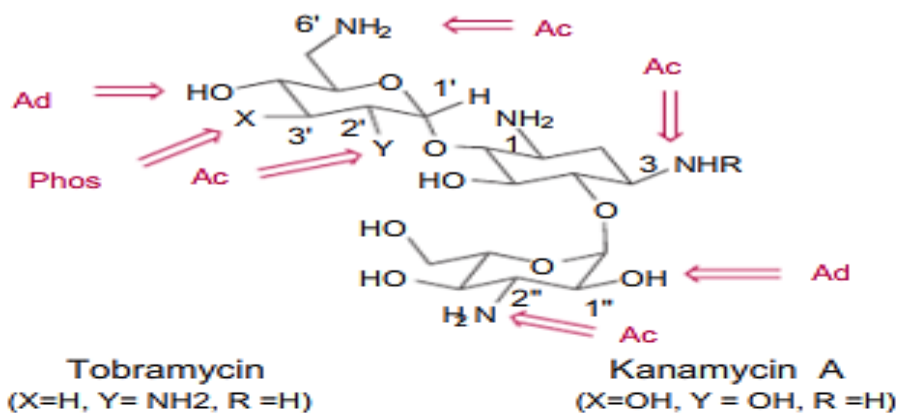
کاهش عملکرد کلیه (نفروتوکسیک)

عارضه مهم ایجاد سرگیجه

ایجاد ضعف عضلانی به خصوص در میاستنی
گراویس و پارکینسون



روابط ساختمان فعالیت



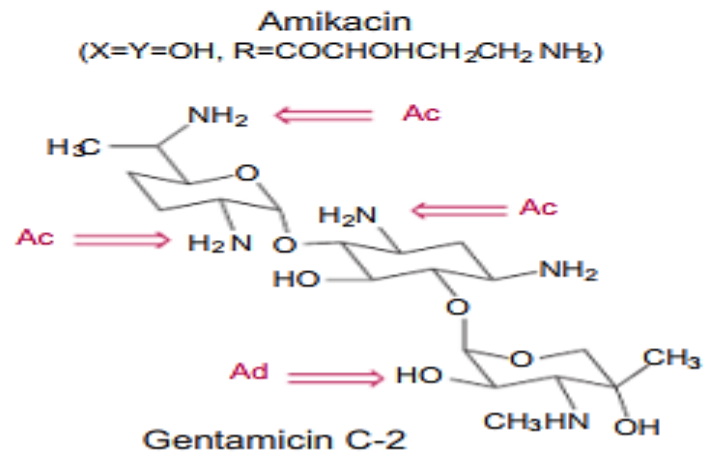
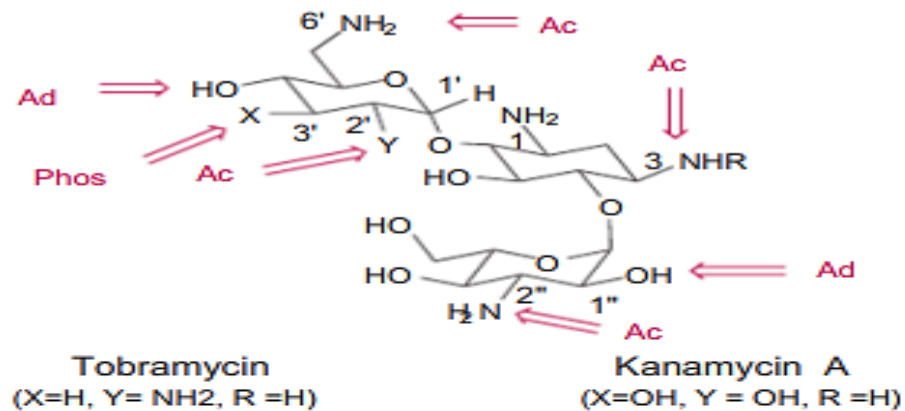
کانامایسین، جنتا، نئو و پارومو--> پایدار از نظر شیمیایی

کانامایسین--> ناپایدار در برابر R-factor enzyme

کانامایسین ناپایدار در برابر استیلایسیون و فسفریلاسیون ۶ پریم و ۳ پریم

بی هوازی و سودومونا--> مقاوم به کانامایسین

روابط ساختمان فعالیت



آمیکاسین <-- حاوی هابا (HABA)

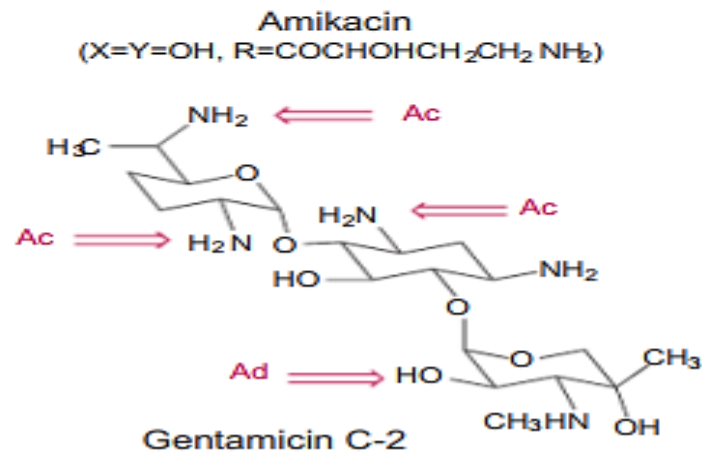
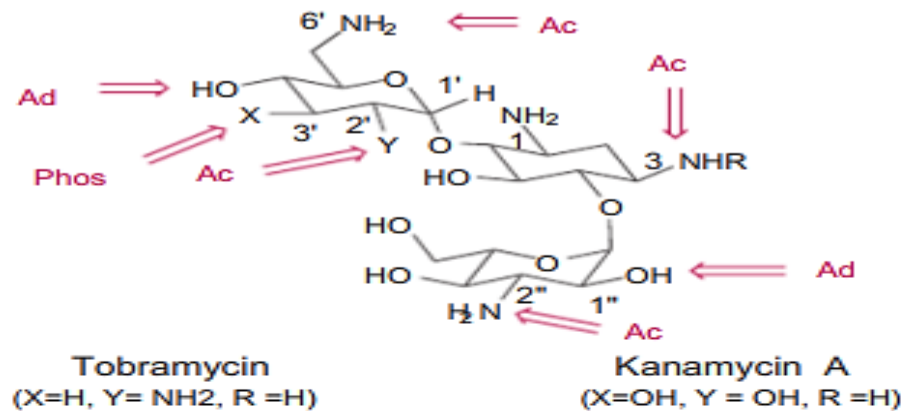
Hydroxyaminobutyryl amide

هابا <-- مهار فسفریلاسیون و آدنیلایسیون در ۲ و ۳

پریم

هابا <-- مسئول افزایش طیف و قدرت اثر آمیکاسین

روابط ساختمان فعالیت



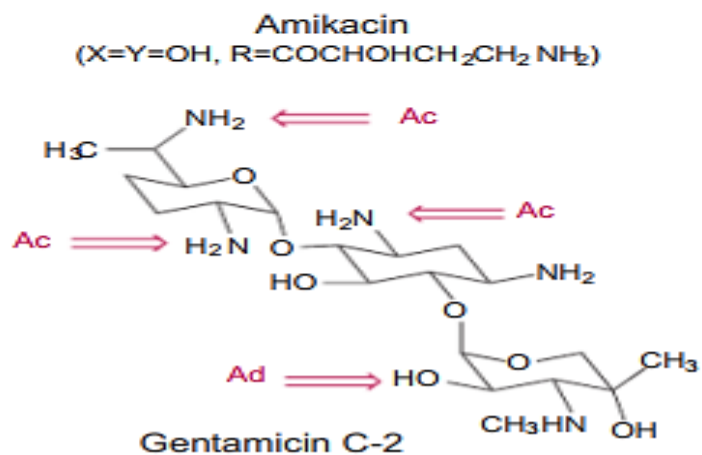
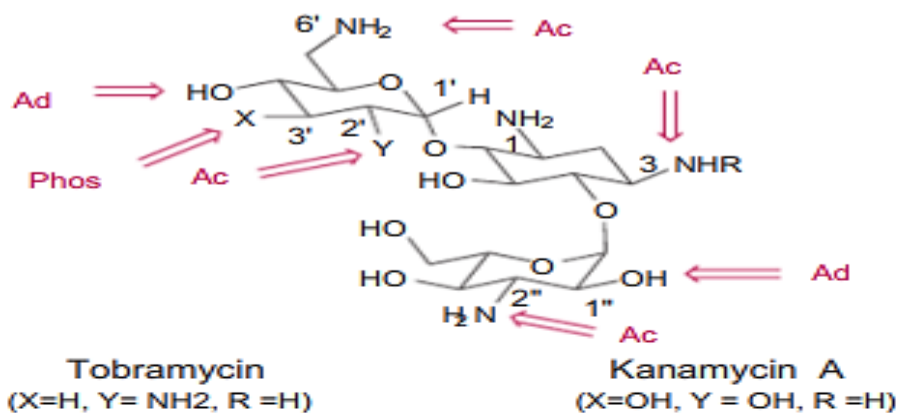
توبرامایسن --< یک هیدروکسی کمتر از کانا

توبرا به دلیل فوق --< قوی تر از کانامایسن

توبرا --< مصرف در سودومونای مقاوم به جنتامایسن

هیدروکسی کمتر توبرا --< مقاوم به فسفریلاسیون در
۳ پریم

روابط ساختمان فعالیت



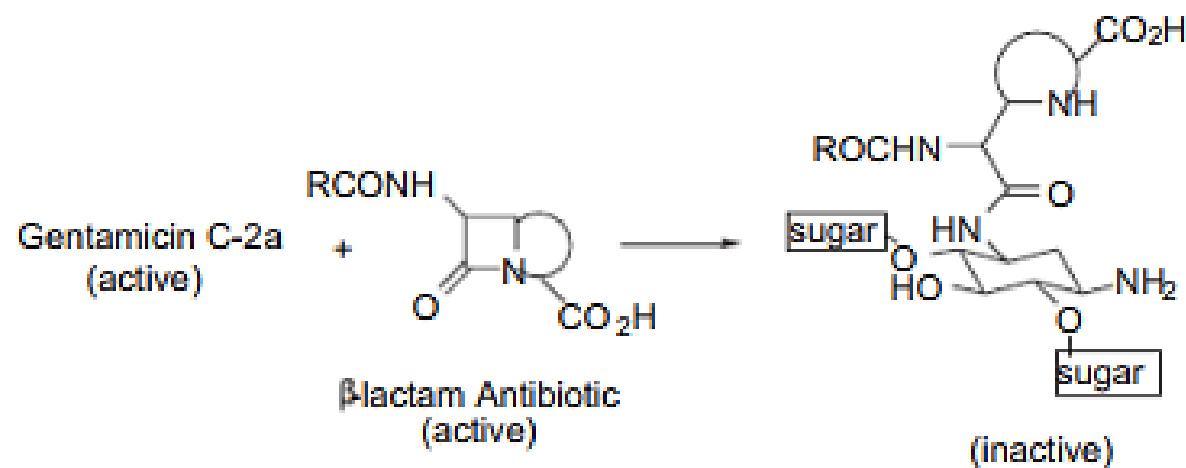
جنتامایسین --> گروه های عاملی و اجزای کمی متفاوت

سودومونا --> بسیار آب دوست --> موثر در عفونت های ادراری، سوختگی و ...

جنتا --> مقاوم به تعدادی آنزیم اما ناپایدار در برابر استیلایسیون و آدنیلایسیون

جنتا --> گرم منفی ها، سوختگی، پنومونی و ...

تداخل فیزیکی شیمیایی بین آمینو گلیکوزید و بتالاکتام ها



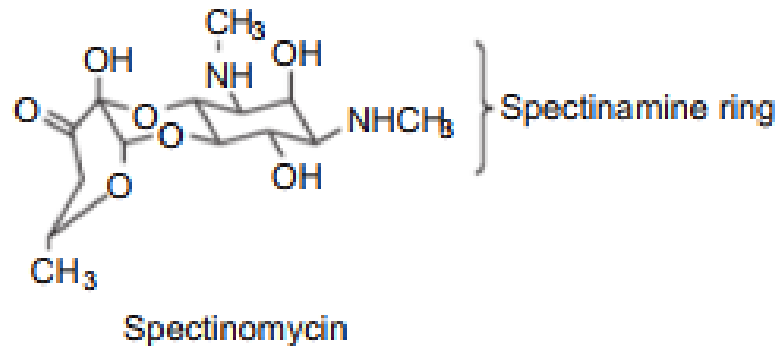
روابط ساختمان فعالیت

اسپکتینومايسين --> سه حلقه فيوز شده

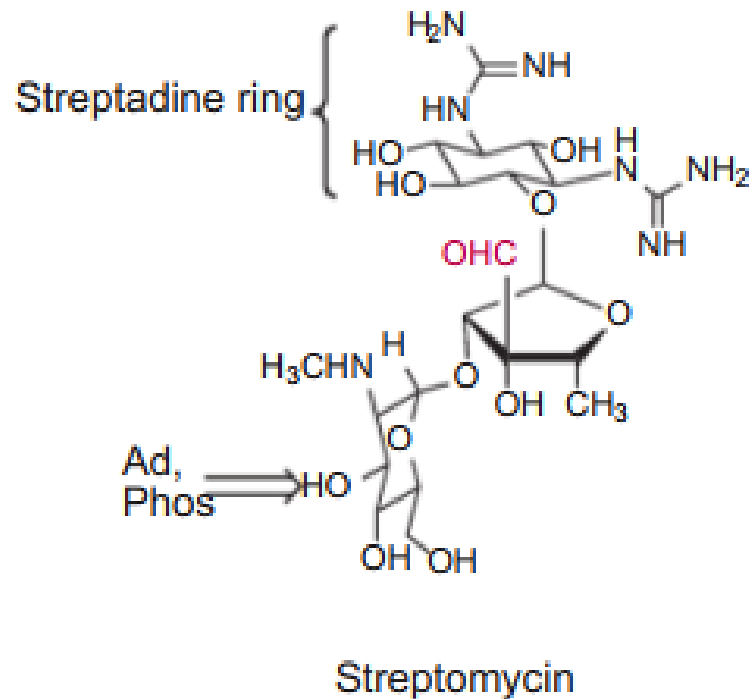
کاربرد --> فقط سوزاک (البته بصورت خط دوم)

باکتریوستاتیک / تزریق بصورت عضلانی

سمیت کلیوی و شنوایی بسیار اندک در دوزهای درمانی



روابط ساختمان فعالیت



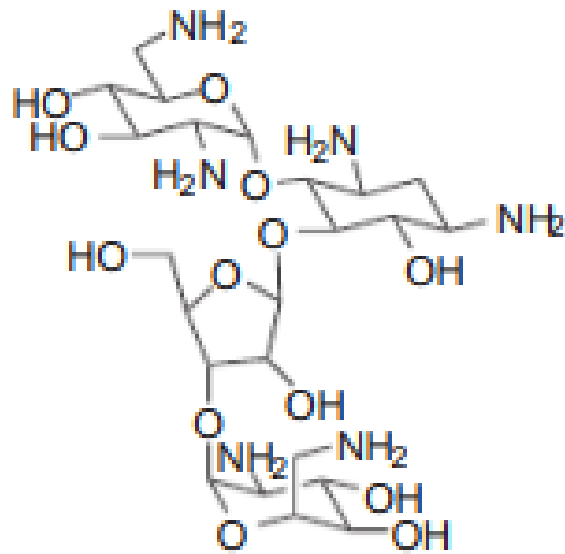
استرپتو--> موثر روی توبرکلوزیس/بروسلوز

فارماکوفور متفاوت با بقیه--> ایجاد طیف اثر خاص

آلفاهیدروکسی آلدهید--> حساس به حرارت و اتوکلاو--> متد دیگر استریلیزاسیون (اولترافیلتر)

مکانیسم مقاومت مشابه دیگر هم گروهی ها

روابط ساختمان فعالیت



Neomycin B

نئومایسین بصورت موضعی --> در عفونت پوستی
باکتریال (تریامسینولون ان ان)

نئومایسین بصورت خوراکی --> کاهش فلور روده
برای جراحی

پارومومایسین --> آمیبیازیس روده (مصرف
خوراکی)

خطر جذب نئومایسین از زخم های باز --> در مصرف
پوستی