

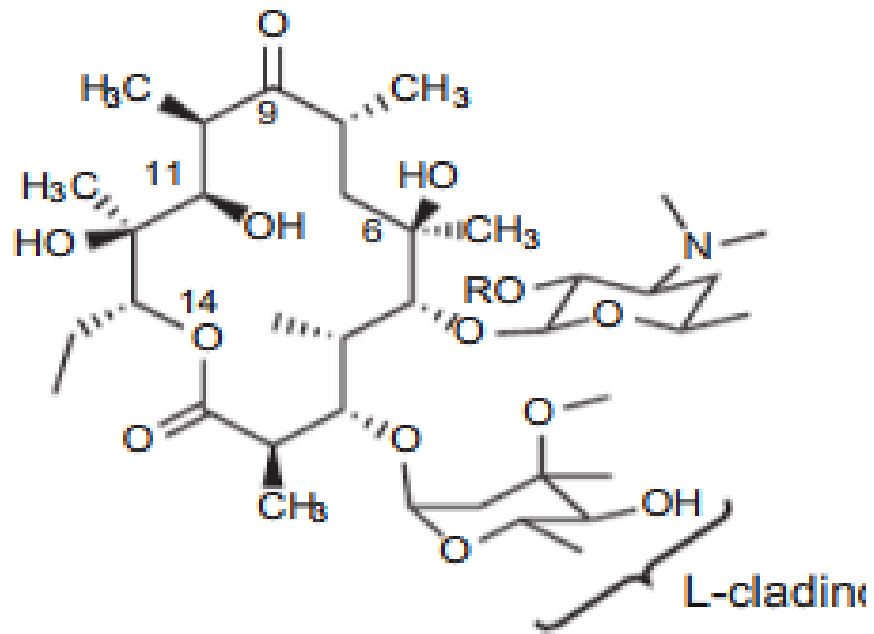
بسمه تعالی

ماکرو لید، کتولید و لینکوز امید ها

تهیه و تنظیم: امیر مهدی ایمان زاده

دکتر داروساز، دانشجوی دکتری تخصصی فارماسیوتیکس علوم پزشکی تبریز

معرفی



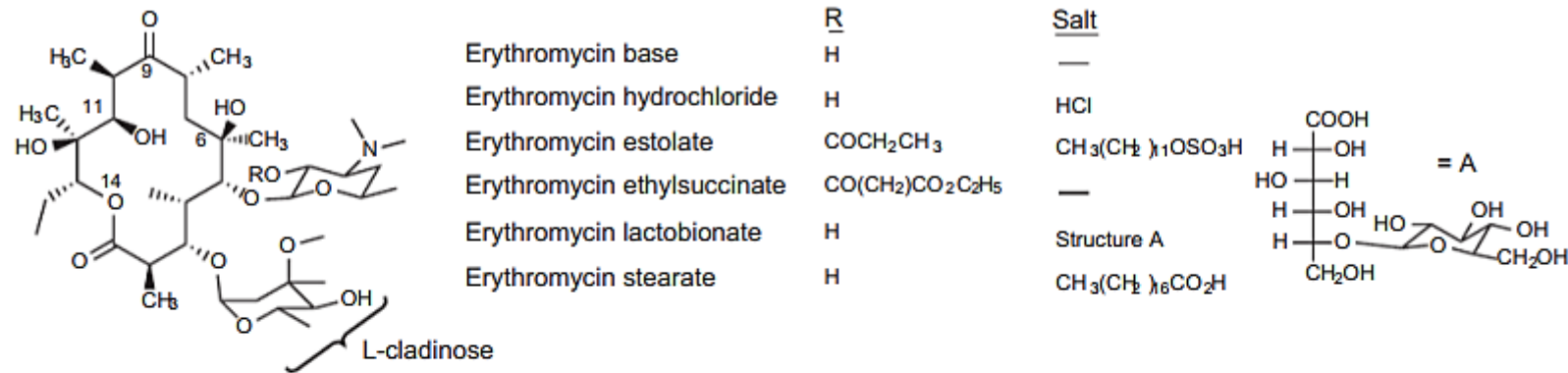
Erythromycin A

ماکرولید--> دارای لاکتون یعنی استر حلقوی

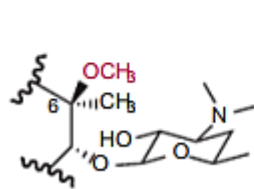
حاوی دو قند مهم کلادینوز و دزوزآمین

مکانیسم: مهار دی هیدروپتروات سنتاز

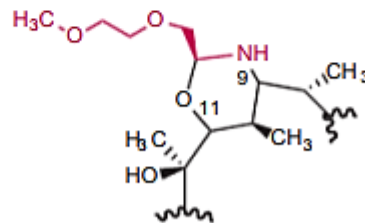
کلیاتی از ماکرولید ها



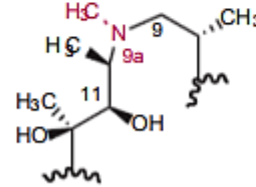
Erythromycin A



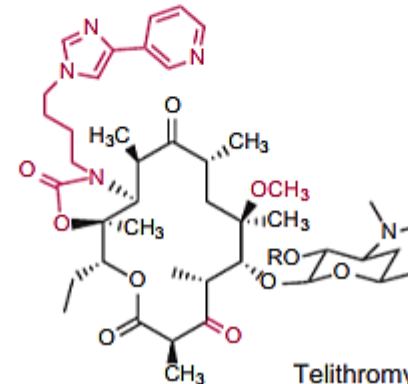
Clarithromycin



Dirithromycin

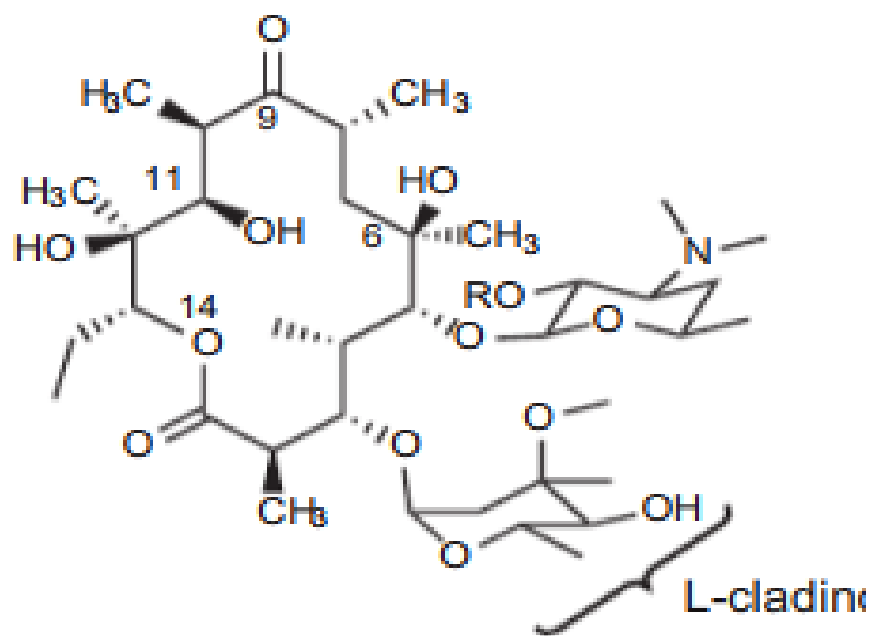


Azithromycin



Telithromycin

روابط ساختمان - فعالیت



Erythromycin A

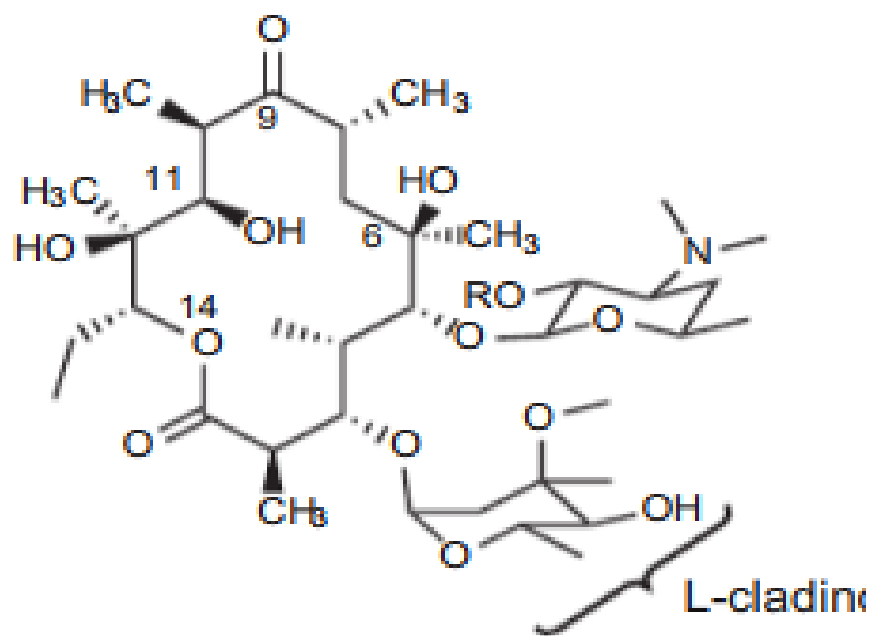
این دسته دارویی --> بصورت باز آزاد (کم محلول)

ملح های لاکتوبیونیک و گلوکوهیتونیک --> افزایش محلولیت آبی

ملح های استئاریک و لوریل سولفات --> کاهشده محلولیت آبی

سنتز شده از واحد های مختلف پروپیونیک اسیدی

روابط ساختمان - فعالیت



Erythromycin A

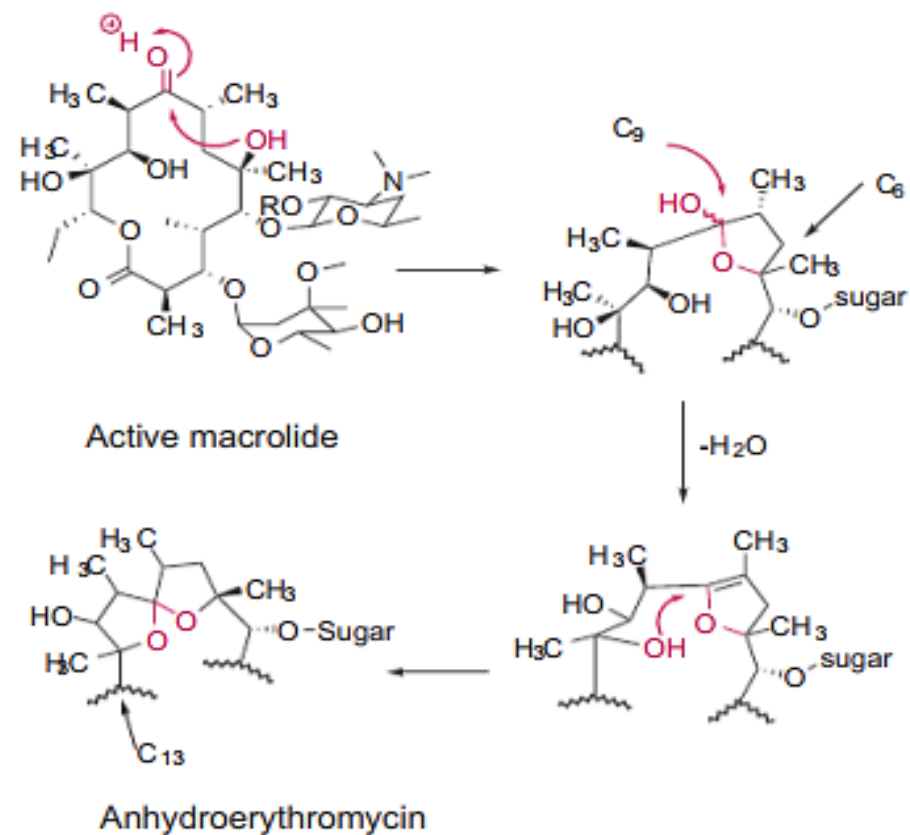
مشکل حساس به کاتالیز اسیدی --> غیر فعال شدن

مشکل طعم بد --> رفع شدن با طراحی فرمولاسیون های نامحلول در آب

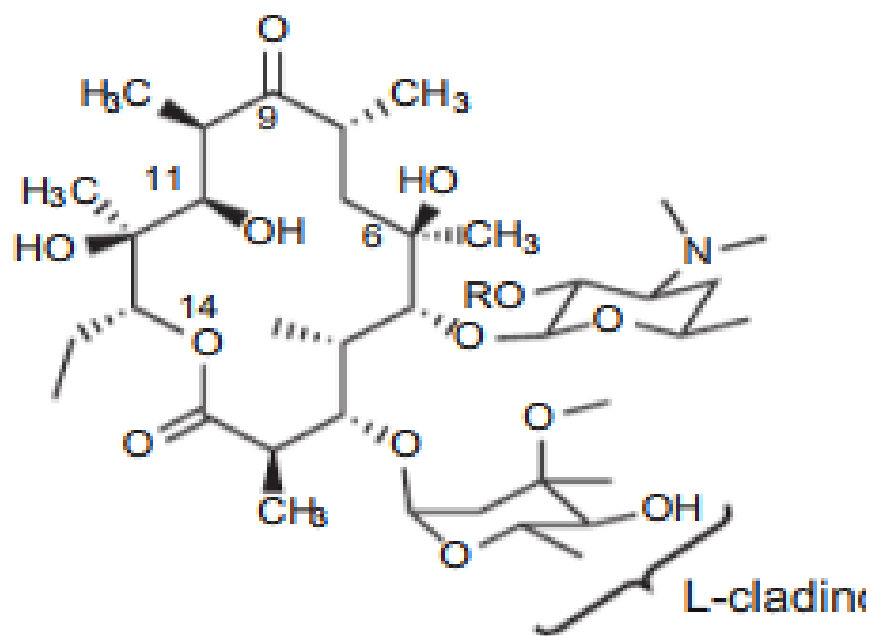
فرم های نامحلول در آب این داروها --> کاهش ناپایداری اسیدی و کرامپ شکمی

پوشش انتریک --> کاهنده عوارض فوق

تشکیل کتال کاتالیز شده توسط اسید در اریترومايسين



روابط ساختمان - فعالیت



Erythromycin A

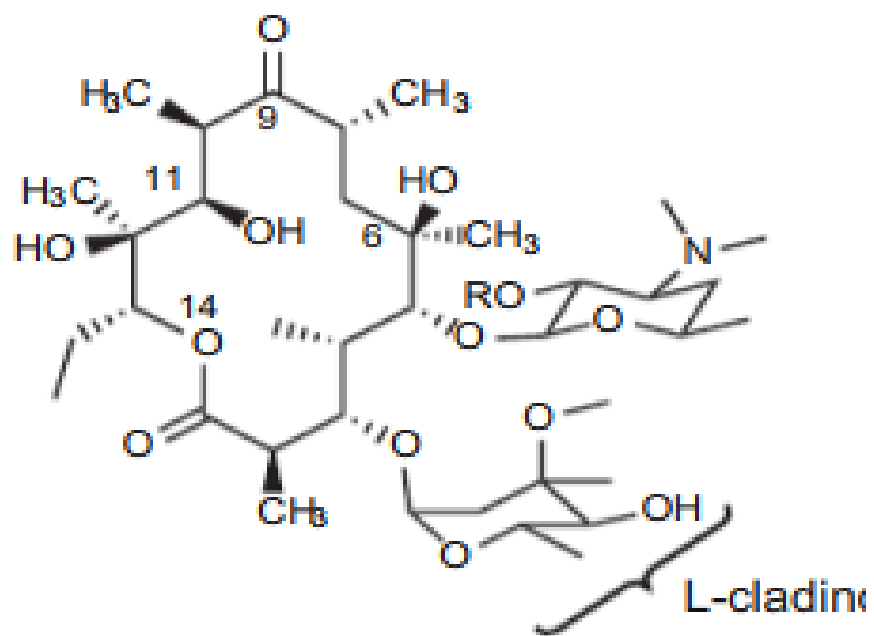
مکانیسم --> اتصال به 23rRNA در زیر واحد 50S

در صورت ایجاد مقاومت به ماکرولید --> متقاطع شدن با کلیندا و کلرامفنیکل

روش های ایجاد مقاومت مثل --> جهش ژنتیکی rRNA در باکتری و پمپ افلاکس

یک روش دیگر --> حضور آنزیم های متیلاتور گوانین

روابط ساختمان - فعالیت



Erythromycin A

این دسته دارویی --> متابولیزه شدن توسط CYP3A4

تشدید تداخلات با حضور مهارکننده P-gp

نتیجه تداخل --> افزایش نیمه عمر دارو

نتیجه تداخل --> افزایش احتمال سمیت دارو

اندیکاسیون

موثر روی باکتری های بدون دیواره مثل کلامیدیا و مایکوپلاسما

عملکردشان بصورت باکتریوستاتیک / موثر روی گرم مثبت ها و استرپتوکوک ها و عفونت های تنفسی تحتانی و فوقانی، حتی هموفیلوس آنفلوآنزا

در ترکیب با ریفامپین در درمان --> مایکوباکتریوم آویوم کمپلکس / کلاریترو در اچ پیلوری

در درمان گنوره و بیماری التهابی لگن --> همانند پنی سیلین ها --> طیف اثر محدود

نکات فارما کو کینتیکی

اریترومایسین / استولات --> ایجاد یرقان و آسیب کبدی

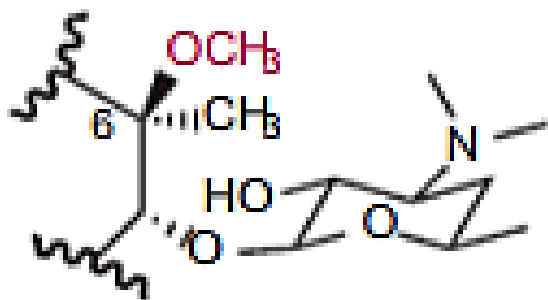
ملح اتیل سوکسینات اریترومایسین --> پوشش بهتر طعم بد --> استفاده در سوسپانسیون --> قابل قبول برای کودکان

ملح استئارات --> بسیار نامحلول --> افزایش ناپایداری در برابر اسید و پوشش بهتر طعم بد

ملح لاکتوبیونات --> افزایش محلولیت آبی --> مناسب برای فرم های تزریقی

نکات ملح بسیار مهم

روابط ساختمان - فعالیت



Clarithromycin

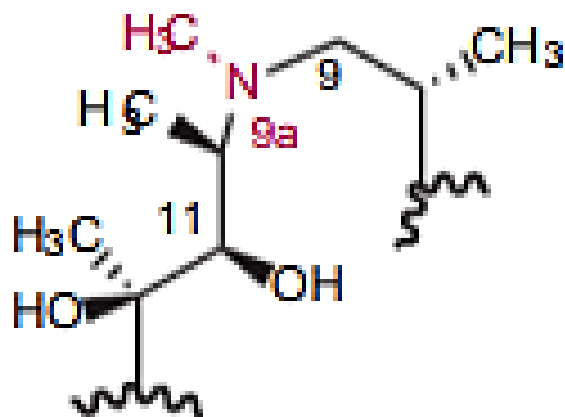
در کربن ۶--> حاوی متوکسی--> کمی
لیوفیل تر شدن--> نیمه عمر بهتر از اریترو

نقش متوکسی--> افزایش پایداری در برابر
اسید--> غلظت بهتر خونی

نقش متوکسی--> جلوگیری از ایجاد فرم
کتال--> کاهش کرامپ شکمی

کلاریترو--> حاوی متابولیت فعال و متابولیسم
کبدی بالا

روابط ساختمان - فعالیت



Azithromycin

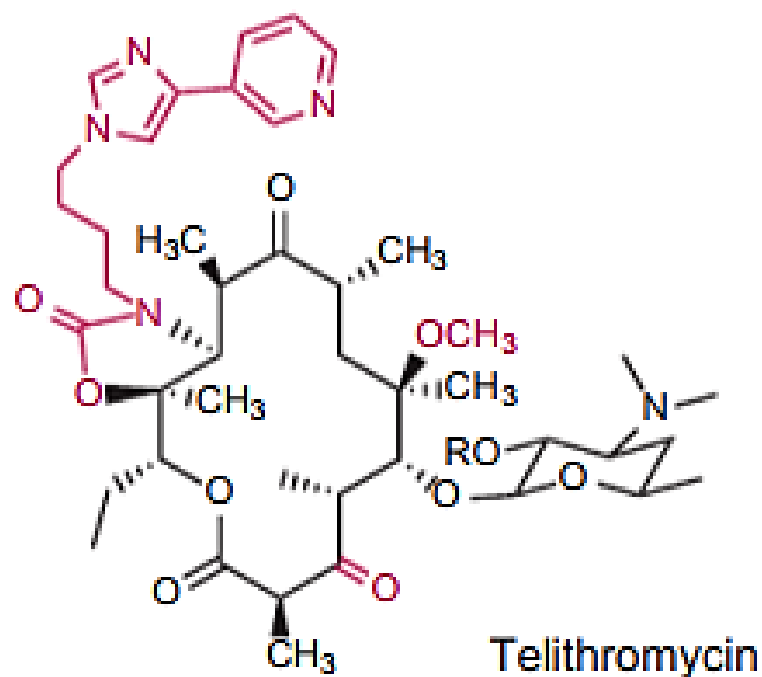
نوعی آزالید--> مقاوم در برابر اسید--> عدم تشکیل کتال

نیمه عمر و نفوذ بافتی بالاتر از اریترو--> قابلیت تجویز بصورت روزانه یکبار

نحوه مصرف--> بامعده خالی بهتر

طیف اثر بالاتر از کلاریترو و اریترو / کاربرد در صورت حساسیت به پنی سیلین ها

روابط ساختمان - فعالیت



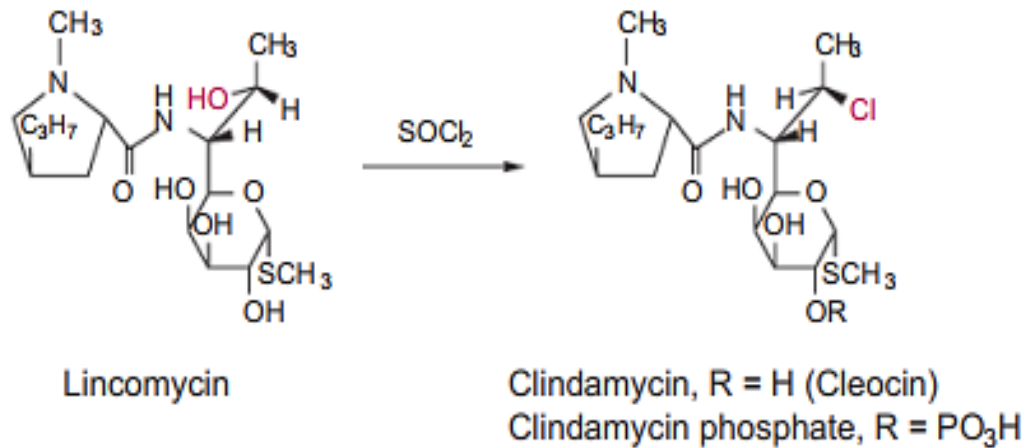
تلیترومایسین --> نوعی کتولید (کربن ۳)

تلیترو --> قسمت پیریدین --> سمی و آنتی
کولینرژیک

موثر روی گونه های مقاوم به اریترومایسین با
مکانیسم متیلاسیون

پیریدین --> مسبب سمیت کبدی

لینکوزامید ها



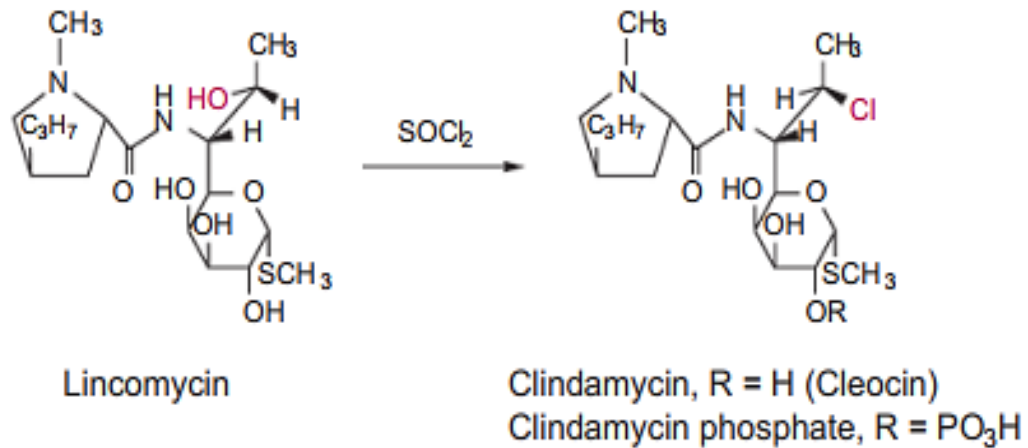
اثر روی گرم مثبت ها و تعدادی بی هوازی

مکانیسم مشابه ماکرولید ها 50S

کلیندا --> کلردار --> جذب بهتر گوارشی و نفوذ بهتر به بافت و استخوان

پرودراگ پالمیتات آن --> بهبود مزه و تلخ نبودن

لینکوزامید ها



در مصرف موضعی --> موثر در آکنه و پروپیونی باکتریوم آکنس

عارضه خطرناک اسهال کلستریدایی

طیف اثر مشابه ماکرولید ها

مناسب در صورت حساسیت به پنی سیلین ها