

بسمه تعالی

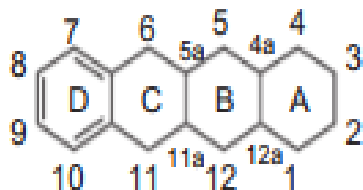
تتراساایکلین و گلی سایکلین ها

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

معرفی اولیه



Naphthalene



Tetracycline

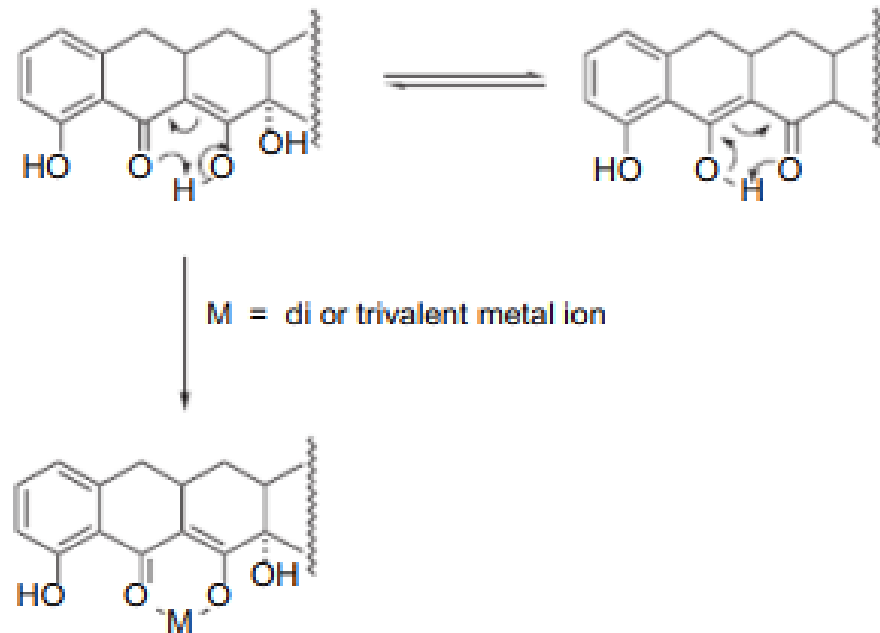
(1,2,3,4,4a,5,5a,6,11,11a,12,12a-dodecahydronaphthalene)

کاربرد در آنتراکس، طاعون، هلیکوباکتر

کاربرد در بروسلوز، مایکوپلاسما، کلآمیدیا

بازی به دلیل ۴-آلفا-دی متیل آمینو

ویژگی های شیمیایی مهم تتراسایکلین ها



تشکیل شلات با کلسیم، منیزیم، آهن و آلومینیوم

تداخل با آنتی اسید ها و پرکلسیم ها

تجمع در استخوان و دندان --> که پرکلسیم ان

زرد یا قهوه ای شدن دندان --> عارضه مهم

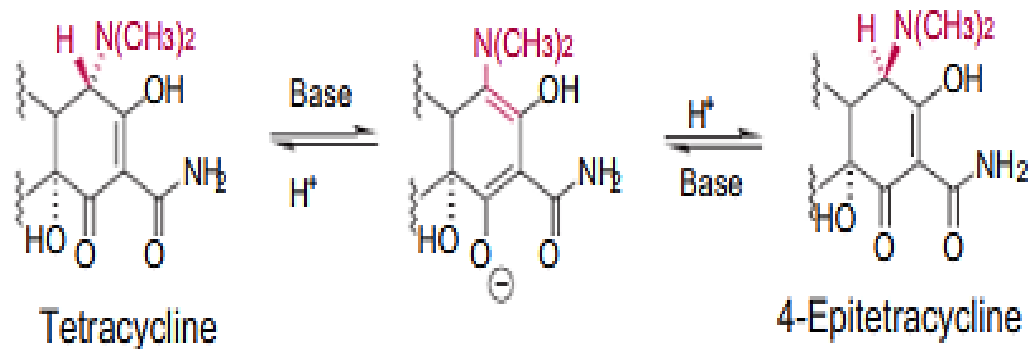
ویژگی های شیمیایی مهم تتراسایکلین ها

دی متیل آمینو در کربن ۴--> تغییر
استرئوشیمی

نام این رویداد--> اپیمریزاسیون

اگر پروتوناسیون از پایین ۴--> اپی
تتراسایکلین--> غیر فعال

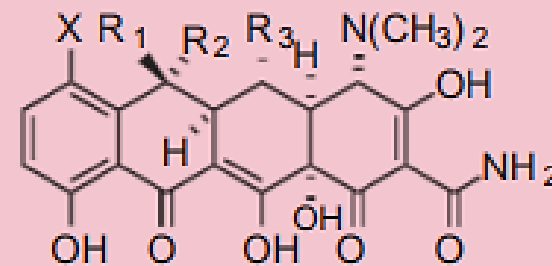
اگر پروتوناسیون مجدد از بالا--> فعال شدن
دوباره



اعضای مهم تتراسایکلین ها

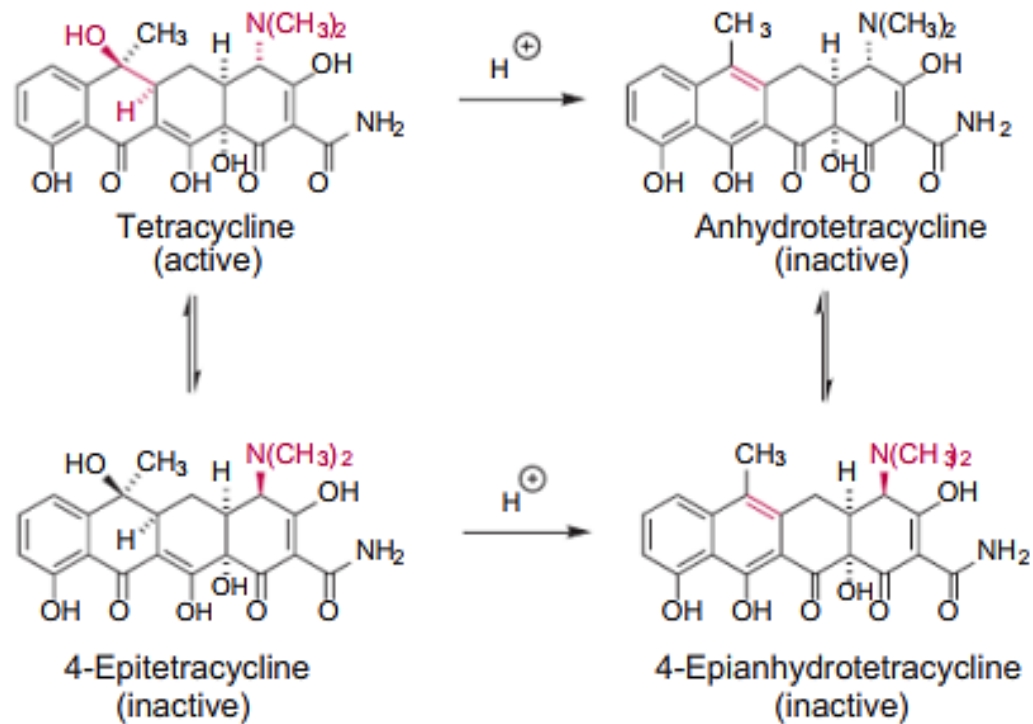
TABLE 33.10 Commercially Available Tetracyclines

Generic Name



	Trade Name	X	R ₁	R ₂	R ₃
Tetracycline	Generic	H	OH	CH ₃	H
Demeclocycline	Declomycin	Cl	OH	H	H
Minocycline	Minocin	N(CH ₃) ₂	H	H	H
Doxycycline	Vibramycin	H	H	CH ₃	OH

ویژگی های شیمیایی مهم تتراسایکلین ها



5a-alpha hydrogen--> trans

نام این رویداد --> دهیدراسیون کاتالیز شده با اسید

انیدروتتراسایکلین --> عامل سندرم فانکونی --
< سمی برای کلیه

مینوسایکلین و داکسی --> نداشتن این ویژگی

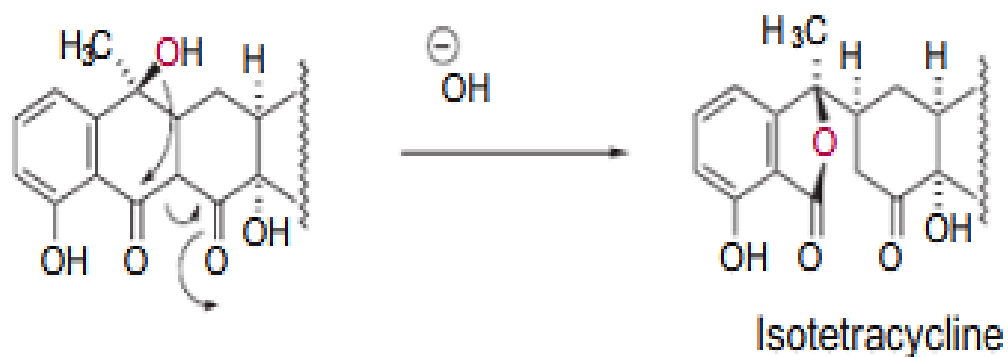
ویژگی های شیمیایی مهم تتراسایکلین ها

ایجاد لاکتون غیرفعال

نام این رویداد --> دگراداسیون بازی

مانند دگراداسیون قبلی --> مهم بودن
هیدروکسی شماره ۶

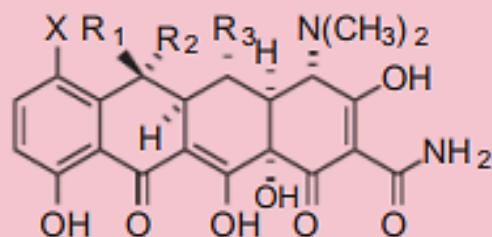
بازشدن حلقه C در محلول های قلیایی



ویژگی های شیمیایی مهم تتراسایکلین ها

TABLE 33.10 Commercially Available Tetracyclines

Generic Name



	Trade Name	X	R ₁	R ₂	R ₃
Tetracycline	Generic	H	OH	CH ₃	H
Demeclocycline	Declomycin	Cl	OH	H	H
Minocycline	Minocin	N(CH ₃) ₂	H	H	H
Doxycycline	Vibramycin	H	H	CH ₃	OH

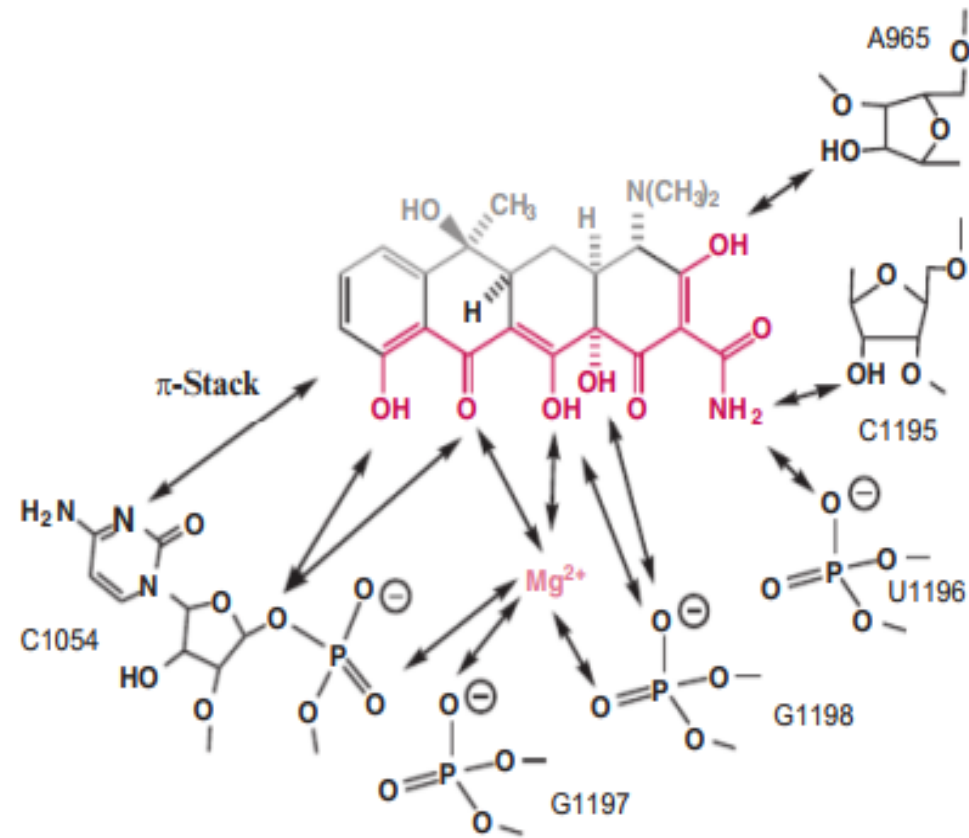
دمکلو--> حاوی کلر در موقعیت ۷

نام این ویژگی --> فوتوتوکسیسته

ایجاد رادیکال های آزاد با جذب نور مرئی

عارضه نادر با تتراسایکلین های جدید

Buy AT 30 = Mechanism of action



اکثرا باکتریواستاتیک

مینوسایکلین (لیوفیل تر) --> باکتری سیدال

مینوسایکلین --> مکانیسم های متعدد

نشت نولکئوتید ها، تغییر نفوذ پذیری غشا

طیف اثر تتراسایکلین ها

بسیار وسیع الطیف

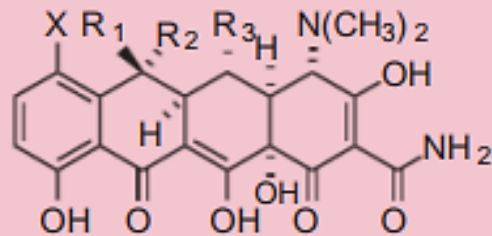
آکنه، بروسلوز، کلامیدیا، عفونت های ریکتسیای (کنه)

مایکوپلاسما، پروفیلاکسی مالاریا، وبا

درمان هلیکوباکتر، بیماری لایم، پیشگیری از اسهال مسافرتی

TABLE 33.10 Commercially Available Tetracyclines

Generic Name

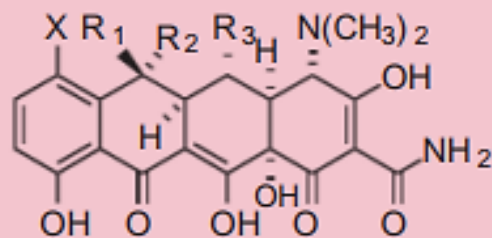


	Trade Name	X	R ₁	R ₂	R ₃
Tetracycline	Generic	H	OH	CH ₃	H
Demeclocycline	Declomycin	Cl	OH	H	H
Minocycline	Minocin	N(CH ₃) ₂	H	H	H
Doxycycline	Vibramycin	H	H	CH ₃	OH

عوارض و مقاومت تتراسایکلین ها

TABLE 33.10 Commercially Available Tetracyclines

Generic Name



	Trade Name	X	R ₁	R ₂	R ₃
Tetracycline	Generic	H	OH	CH ₃	H
Demeclocycline	Declomycin	Cl	OH	H	H
Minocycline	Minocin	N(CH ₃) ₂	H	H	H
Doxycycline	Vibramycin	H	H	CH ₃	OH

در زنان حامله --> منع مصرف

القاکننده آنزیم کبدی --> قادر به کاهش سطح خونی داکسی سایکلین

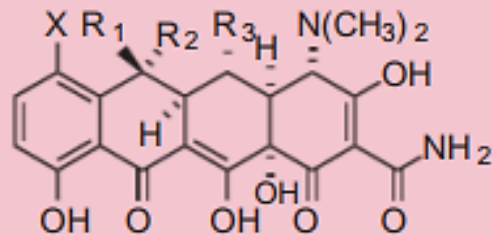
مکانیسم مقاومت مثل پمپ های افلاکس، تغییرات پروتین سازی

در موارد مقاومت شدید --> گلی سایکلین ها

نکات مهم هر عضو از تتراسایکلین ها

TABLE 33.10 Commercially Available Tetracyclines

Generic Name



	Trade Name	X	R ₁	R ₂	R ₃
Tetracycline	Generic	H	OH	CH ₃	H
Demeclocycline	Declomycin	Cl	OH	H	H
Minocycline	Minocin	N(CH ₃) ₂	H	H	H
Doxycycline	Vibramycin	H	H	CH ₃	OH

دمکلو--< ایجاد دیابت بی مزه در طولانی مدت

دمکلو--< کاربرد در ترشح نابجای هورمون ضد ادراری (SIADH)

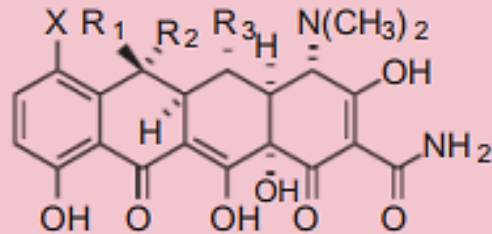
ماینوسایکلین--< طیف اثر وسیع تر / جذب خوراکی بهتر

ماینوسایکلین--< عوارض خاص وستیبولار یعنی سرگیجه، عدم تعادل و تهوع

نکات مهم هر عضو از تتراسایکلین ها

TABLE 33.10 Commercially Available Tetracyclines

Generic Name



	Trade Name	X	R ₁	R ₂	R ₃
Tetracycline	Generic	H	OH	CH ₃	H
Demeclocycline	Declomycin	Cl	OH	H	H
Minocycline	Minocin	N(CH ₃) ₂	H	H	H
Doxycycline	Vibramycin	H	H	CH ₃	OH

داکسی--> بسیار پرمصرف

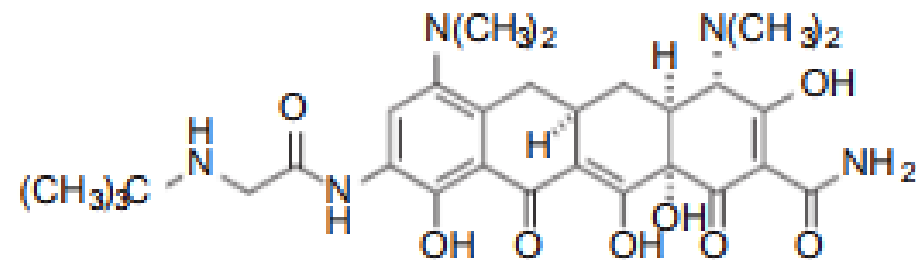
داکسی--> جذب خوراکی عالی

داکسی--> بهترین جذب در حالت ناشتا

تیگه سایکلین--> مصرف به صورت وریدی

نکات مهم هر عضو از تتراسایکلین ها

تیگه سایکلین --> حاوی آمید در موقعیت ۹



Tigecycline
(Tygacil)

مورد مصرف --> عفونت های پیچیده در پوست و داخل شکمی

تیگه سایکلین --> ترومبوفلیت و واکنش محل تزریق

بسیار طیف وسیع تر