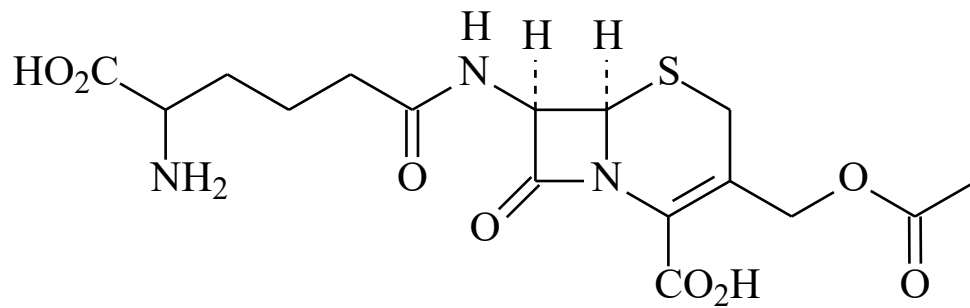
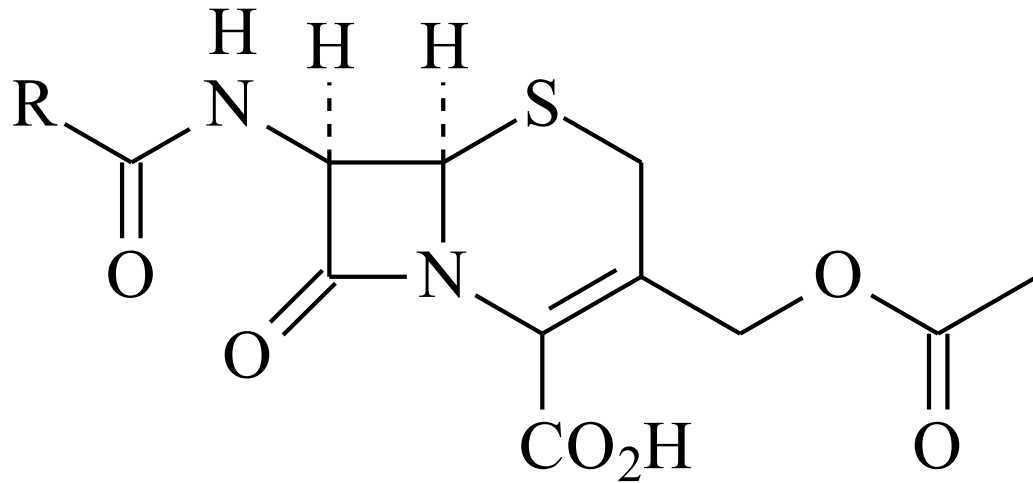
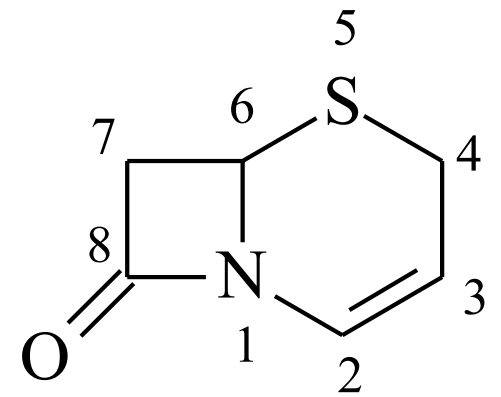


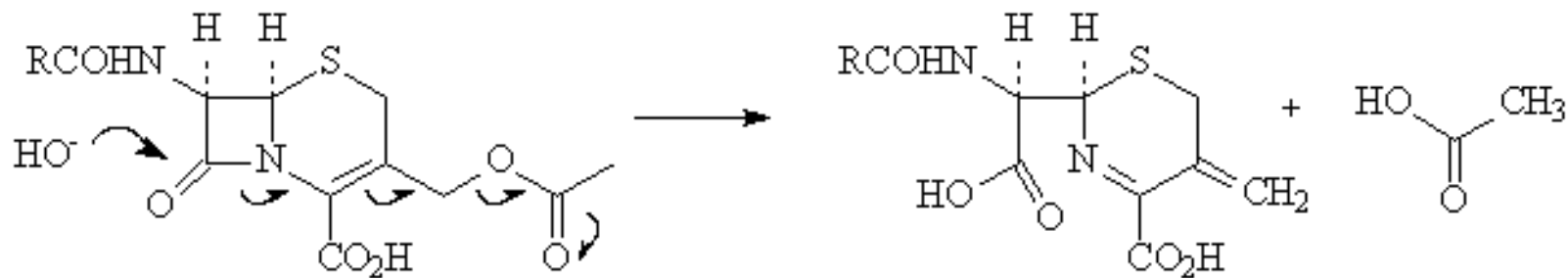
# ΚΕΦΑΛΟΣΠΟΡΙΝΕΣ



cephalosporin C



3-μεθυλοκαρβονυλοξυμεθυλο-8-οξο-7-αλκυλοκαρβονυλαμινο-5-θεια-1-αζαδικυκλο[4.2.0]οκτ-2-ενο-2-καρβοξυλικό οξύ

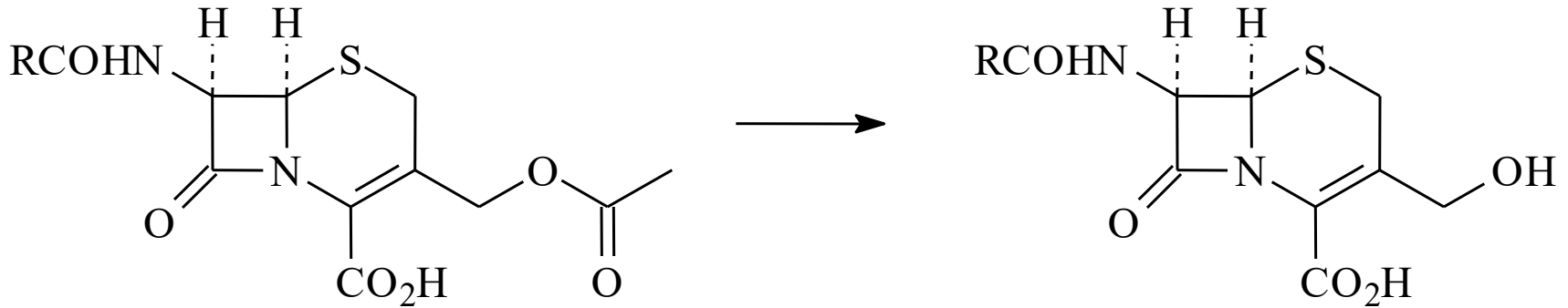


**Διάνοιξη δακτυλίου**

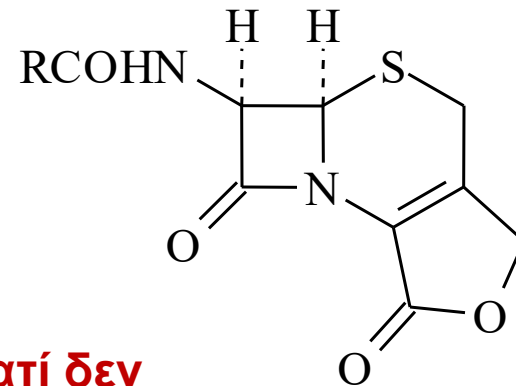
**Προσβολή από PBP's**

**Προσβολή από β-λακταμάσες**

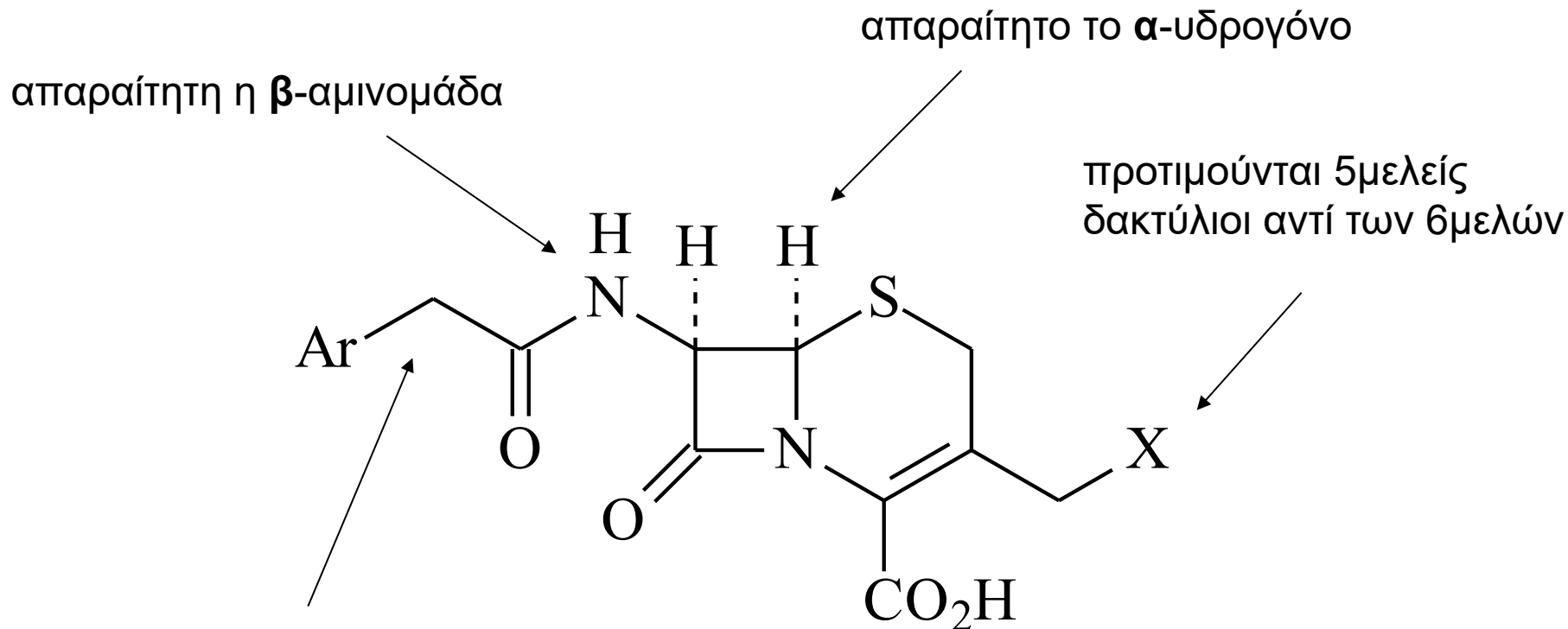
## Μεταβολισμός C-3 ακετοξυ-παραγώγων



Σημαντικά απενεργοποιημένο παράγωγο, γιατί το OH δεν είναι καλή αποχωρούσα ομάδα



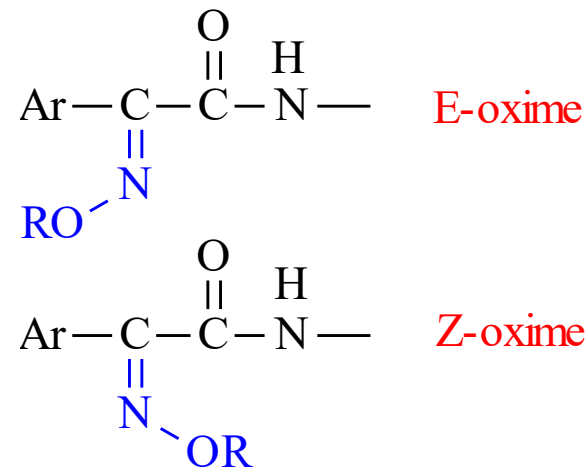
Αδρανές παράγωγο γιατί δεν αναγνωρίζεται από το ένζυμο



Προσθήκη NH<sub>2</sub> (NH<sub>3</sub><sup>+</sup>), αύξηση σταθερότητας β-λακταμικού δακτυλίου (χορήγηση per os)

Με προσθήκη αλκυλοξιμών επιτυγχάνεται 100πλάσια δράση

Οι Z-οξίμες είναι 20.000 φορές σταθερότερες των E-οξιμών έναντι της επίδρασης β-λακταμασών



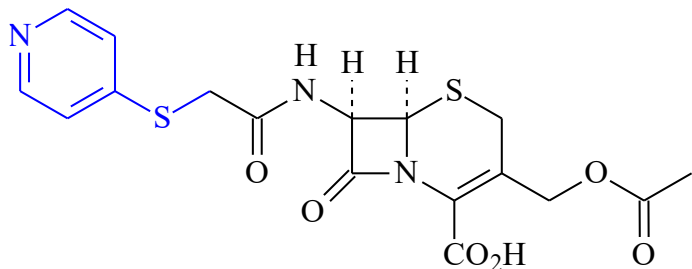
# Κεφαλοσπορίνες 1<sup>ης</sup> γενιάς

Δραστικές έναντι Gram+ κόκκων (*Staphylococcus aureus*, *S. epidermis*) και στρεπτοκόκκων (*Streptococcus pyogenes*, *Str. agalastiae*, *Str. pneumoniae*)  
Αδρανείς έναντι MRSA

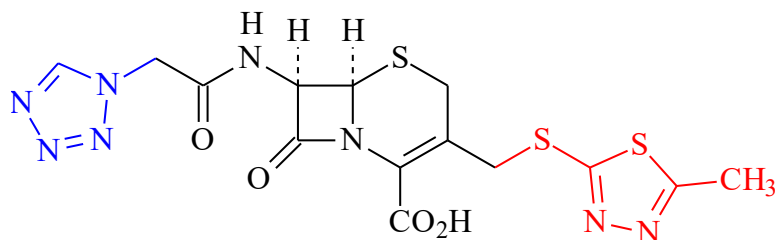
Μη δραστικές έναντι Gram- βακτηρίων.

Παρόλα αυτά, ορισμένα στελέχη μπορεί να είναι ευαίσθητα (*Escherichia coli*, *Klebsiella pneumoniae*, *Proteus mirabilis*, *Shigella sp*)

## Κεφαλοσπορίνες 1<sup>ης</sup> γενιάς ΧΟΡΗΓΗΣΗ ΠΑΡΕΝΤΕΡΙΚΗ

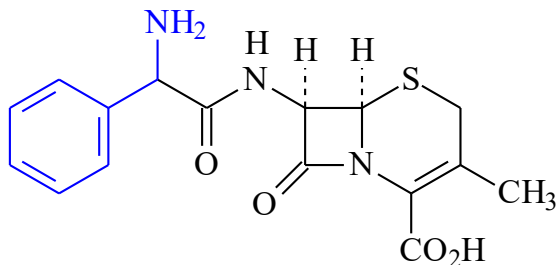


cephapirin

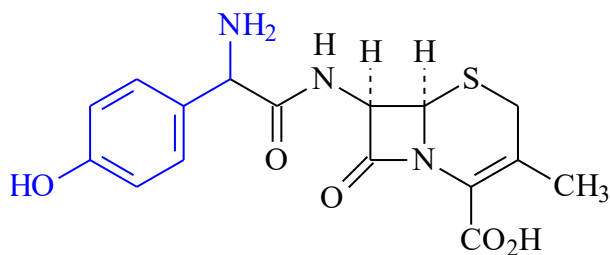


cefazolin

## Κεφαλοσπορίνες 1<sup>ης</sup> γενιάς ΧΟΡΗΓΗΣΗ ΑΠΟ ΤΟ ΣΤΟΜΑ

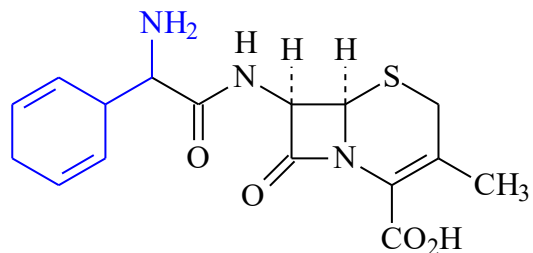


cephalexin



cefadroxil

## Κεφαλοσπορίνες 1<sup>ης</sup> γενιάς ΧΟΡΗΓΗΣΗ ΚΑΙ ΑΠΟ ΤΙΣ ΔΥΟ ΟΔΟΥΣ



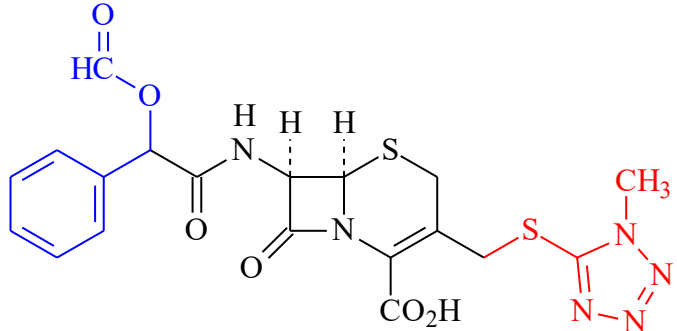
cephradine

# Κεφαλοσπορίνες 2<sup>ης</sup> γενιάς

Διατηρούν τη δράση της προηγούμενης κατηγορίας έναντι των Gram+

Έχουν επίσης αξιόλογη δράση έναντι ορισμένων στελεχών Gram- (*Actinobacter*, *Citrobacter*, *Enterobacter*, *Escherichia coli*, *Klebsiella*, *Neisseria*, *Proteus*, *Providencia*, *Serratia*)

## Κεφαλοσπορίνες 2<sup>ης</sup> γενιάς ΧΟΡΗΓΗΣΗ ΠΑΡΕΝΤΕΡΙΚΗ

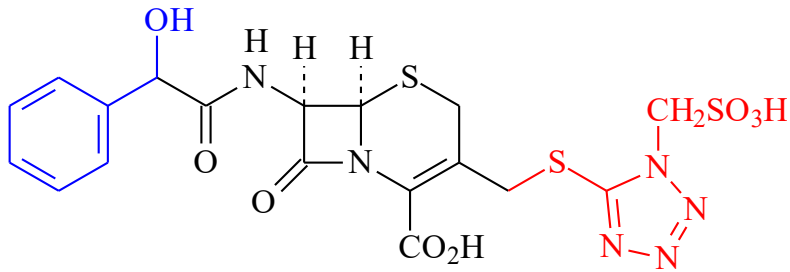


cefamandole

### Προφάρμακο

(υδρόλυση μυρμηκικού εστέρα)

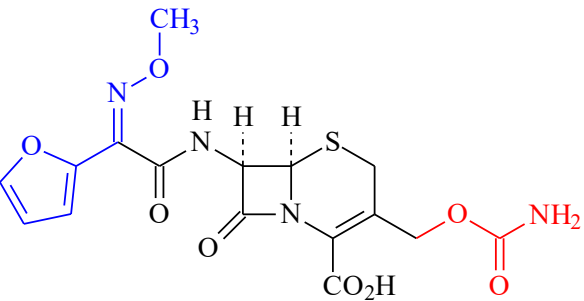
Το 5-θειο-1-μεθυλο-1*H*-τετραζόλιο (MTT) όταν αποσπαστεί μπορεί να προκαλέσει **προβλήματα πηκτικότητας (αιμορραγίες)** και οξύ αίσθημα αντίστοιχο της δυσανεξίας στο αλκοόλ



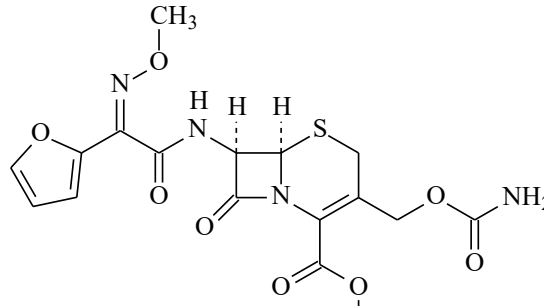
cefonicid

Δεν έχουν αναφερθεί παρενέργειες λόγω πηκτικότητας αίματος

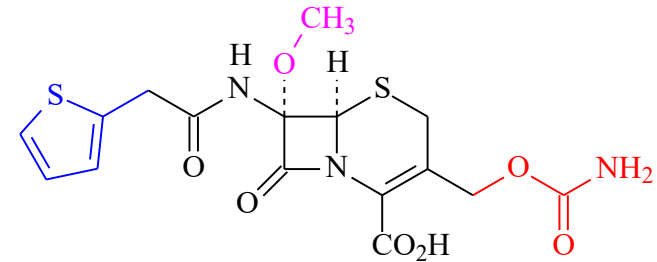
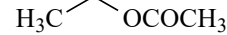
## Κεφαλοσπορίνες 2<sup>ης</sup> γενιάς ΧΟΡΗΓΗΣΗ ΠΑΡΕΝΤΕΡΙΚΗ



cefuroxime

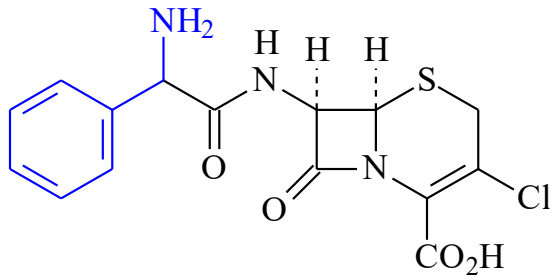


cefuroxime axetil

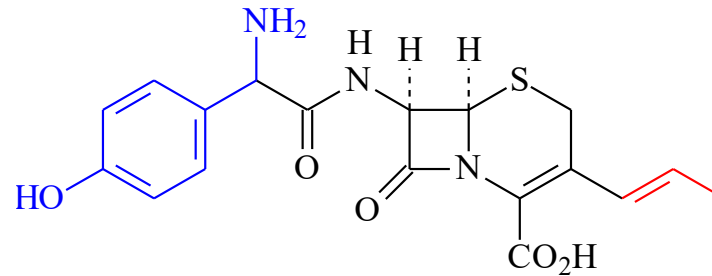


cefoxitin

## Κεφαλοσπορίνες 2<sup>ης</sup> γενιάς ΧΟΡΗΓΗΣΗ ΑΠΟ ΤΟ ΣΤΟΜΑ



cefaclor



cefprozil

# Κεφαλοσπορίνες 3<sup>ης</sup> γενιάς

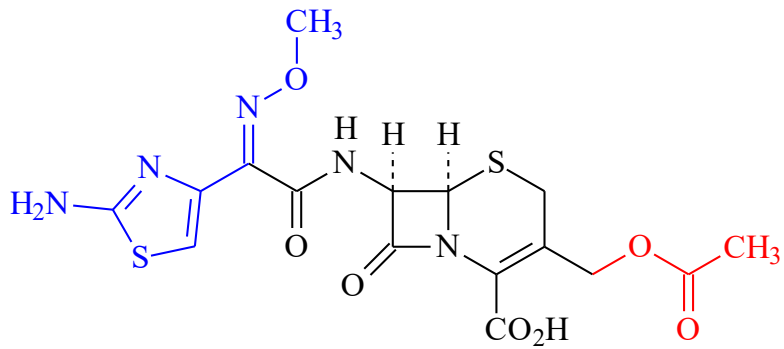
Είναι λιγότερο δραστικές έναντι σταφυλοκόκκων από τις αντίστοιχες της 1<sup>ης</sup> γενιάς, αλλά είναι σημαντικά δραστικότερες έναντι Gram- βακτηρίων από τις κεφαλοσπορίνες 1<sup>ης</sup> και 2<sup>ης</sup> γενιάς

Επίσης δραστικές έναντι *Morganella sp*, *Pseudomonas aeruginosa*

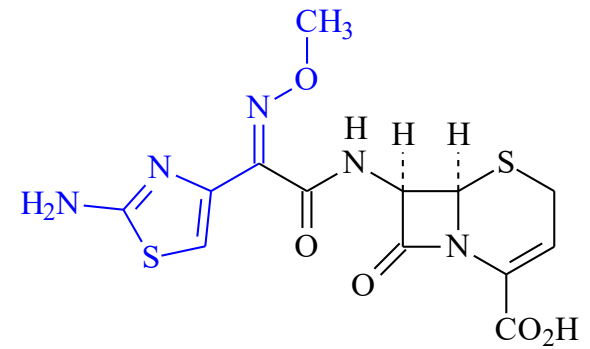
Χρήσιμες στις ενδονοσοκομειακές λοιμώξεις από ανθεκτικά στελέχη

Μειονέκτημα το υψηλό κόστος

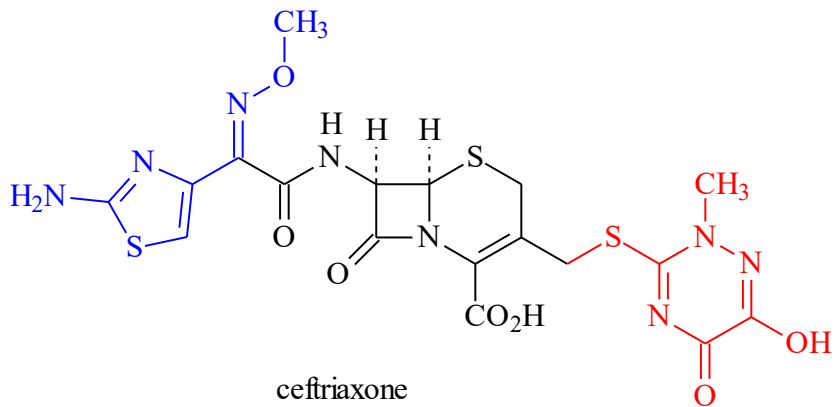
# Κεφαλοσπορίνες 3<sup>ης</sup> γενιάς ΧΟΡΗΓΗΣΗ ΠΑΡΕΝΤΕΡΙΚΗ



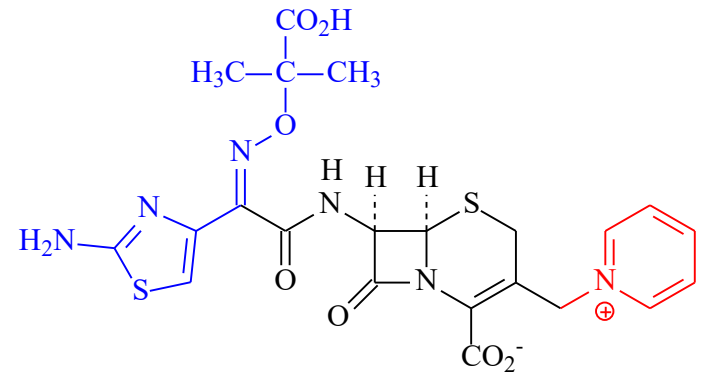
cefotaxime



ceftizoxime



ceftriaxone



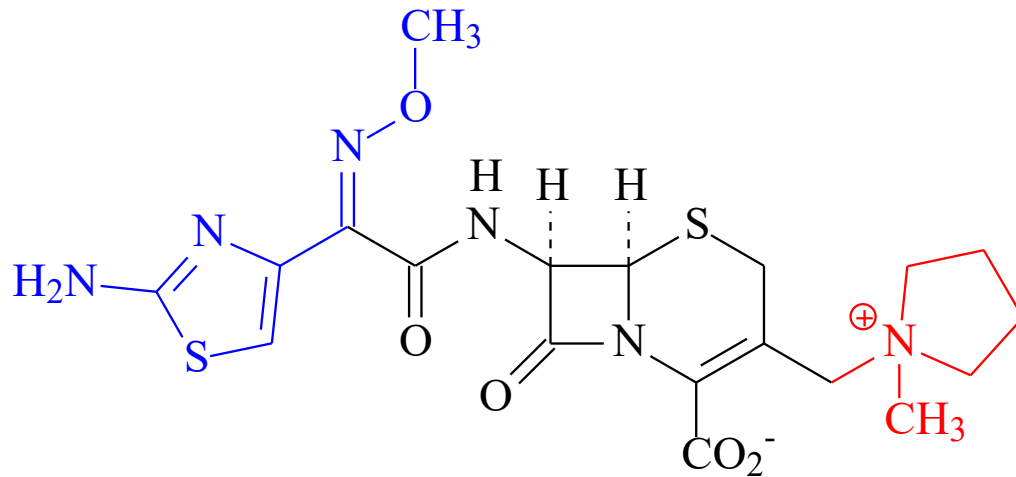
ceftazidime



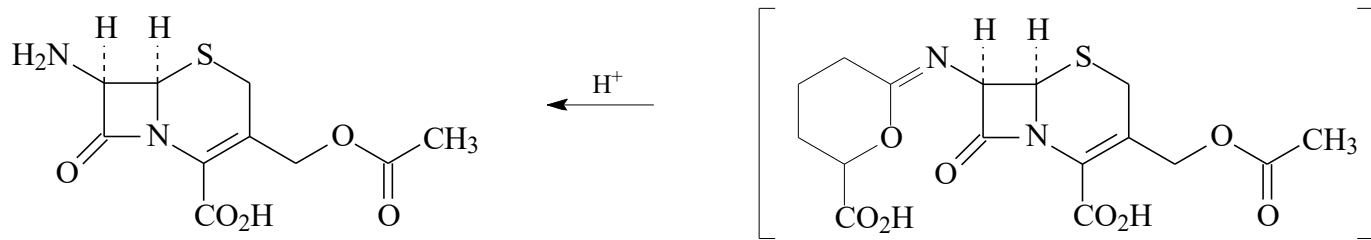
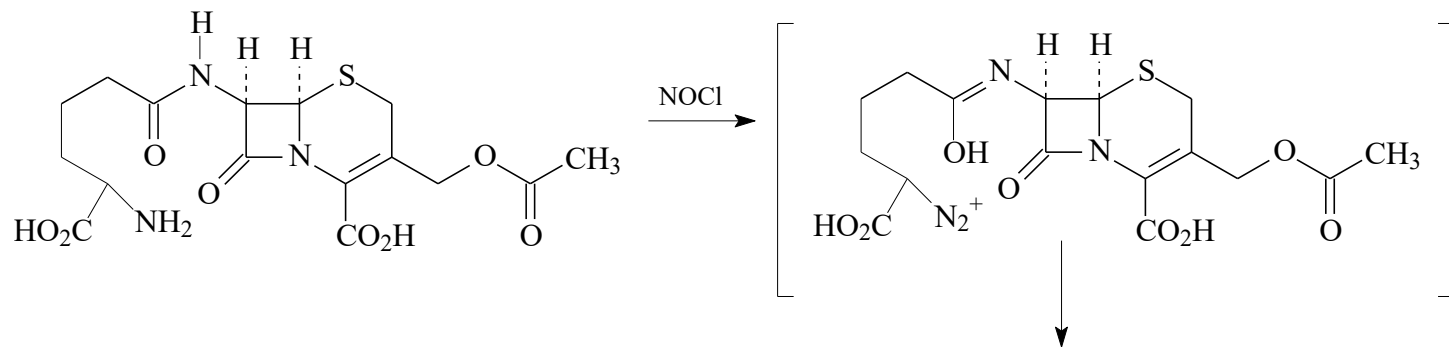
## Κεφαλοσπορίνες 4<sup>ης</sup> γενιάς

Παρόμοια αντιβακτηριακό φάσμα με αυτές της 3<sup>ης</sup> γενιάς, αλλά έχουν δράση έναντι ορισμένων εντεροβακτηρίων ανθεκτικών στην προηγούμενη κατηγορία.

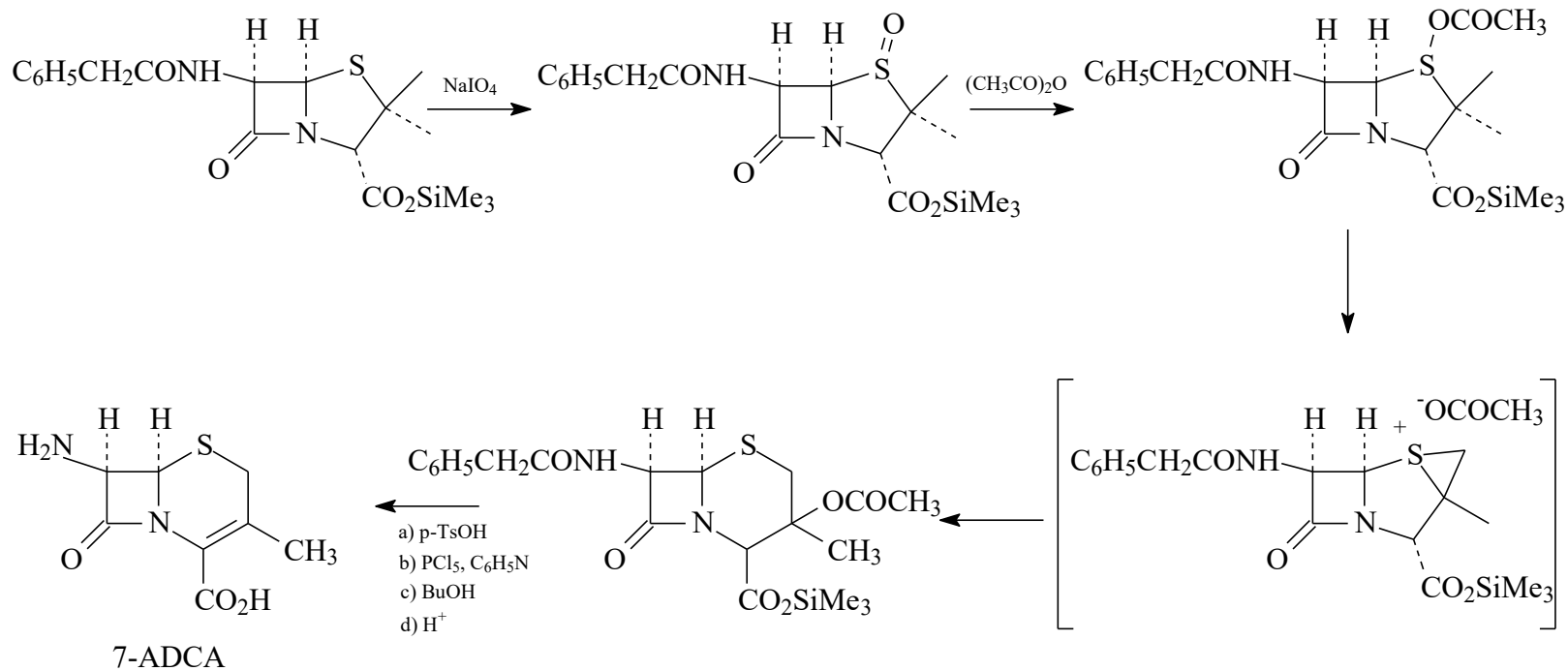
Επίσης είναι δραστικότερες έναντι των Gram+



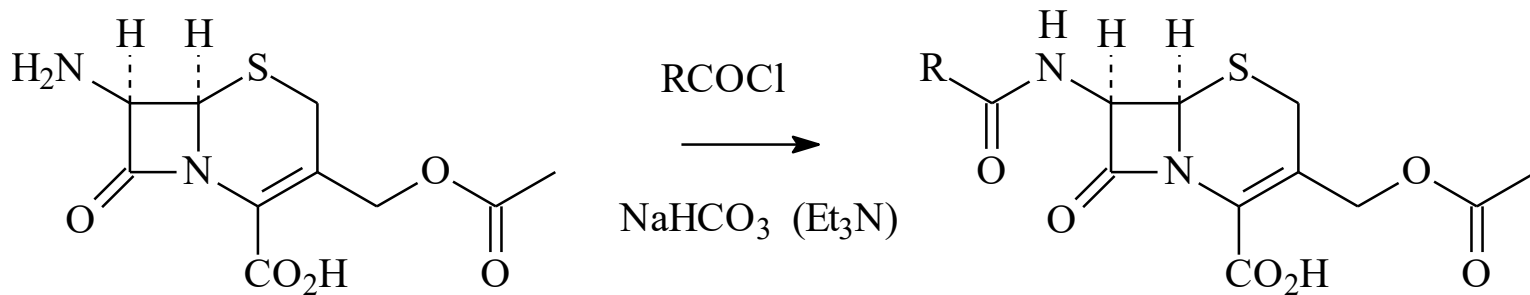
cefepime



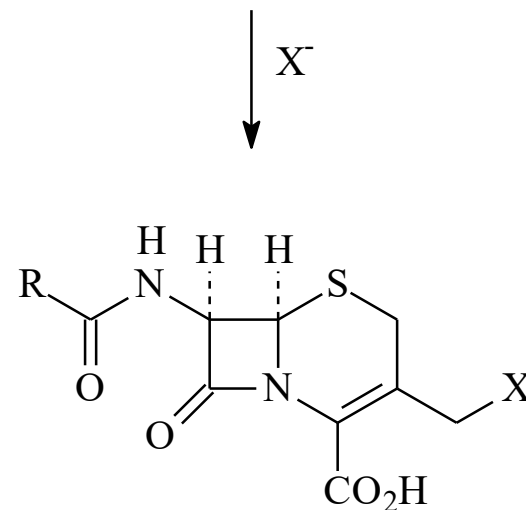
7-ACA



## Μέθοδος σύνθεσης κεφαλοσπορινών

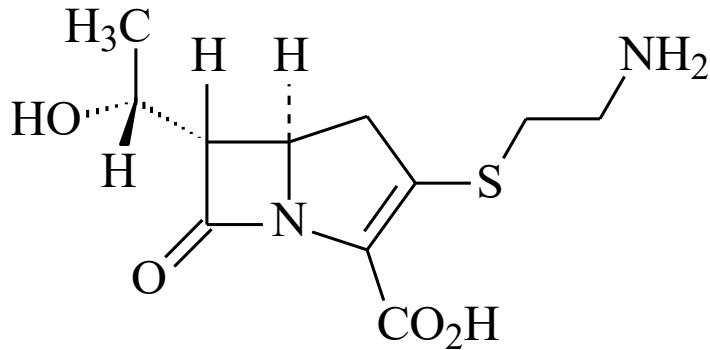


7-αμινοκεφαλοσπορανικό οξύ (7-ACA)



# Καρμπαπενέμες

μεγάλη τάση διάνοιξης δακτυλίου



thienamycin

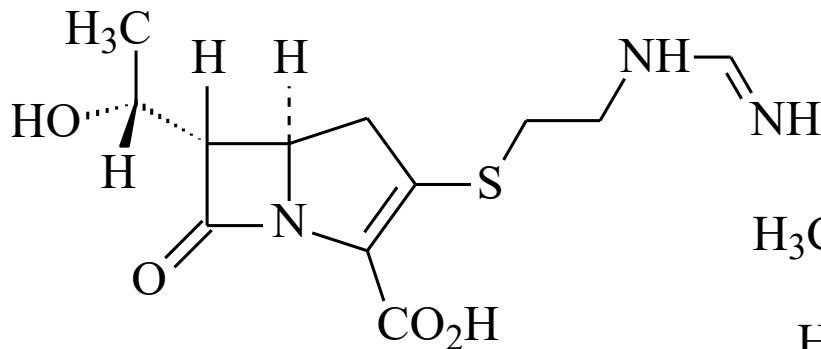
Συνδυάζει:

- **Ισχυρή & ευρέος φάσματος δράση**, λόγω εύκολης διόδου μέσω πορινών
- **απενεργοποίηση πολλών β-λακταμασών**

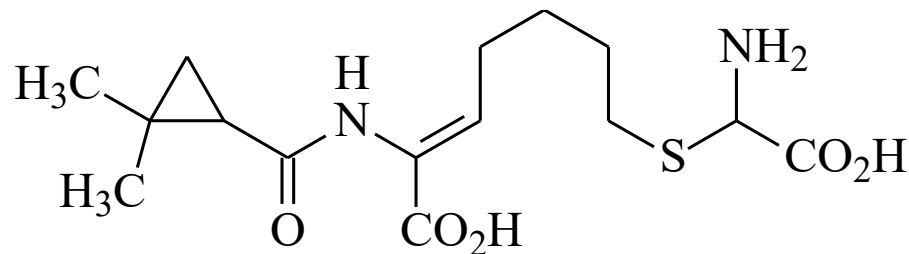
**Αποτελεσματικότετος** συνδυασμός κατά σοβαρών μολύνσεων Gram- αλλά και σταφυλοκοκκικών.

Δεν εισέρχεται στο ΚΝΣ.

Επάγεται όμως η σύνθεση β-λακταμασών γι αυτό χρησιμοποιείται σε ειδικές περιπτώσεις.

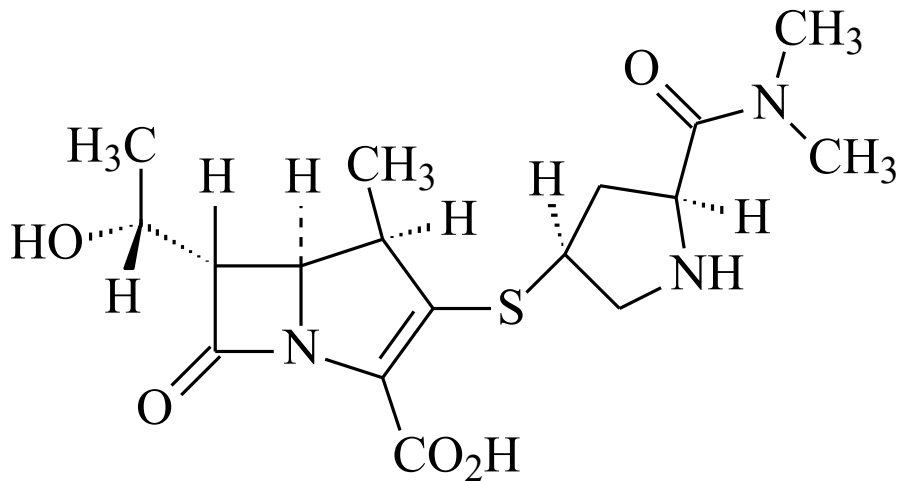


imipenem



cilastatin

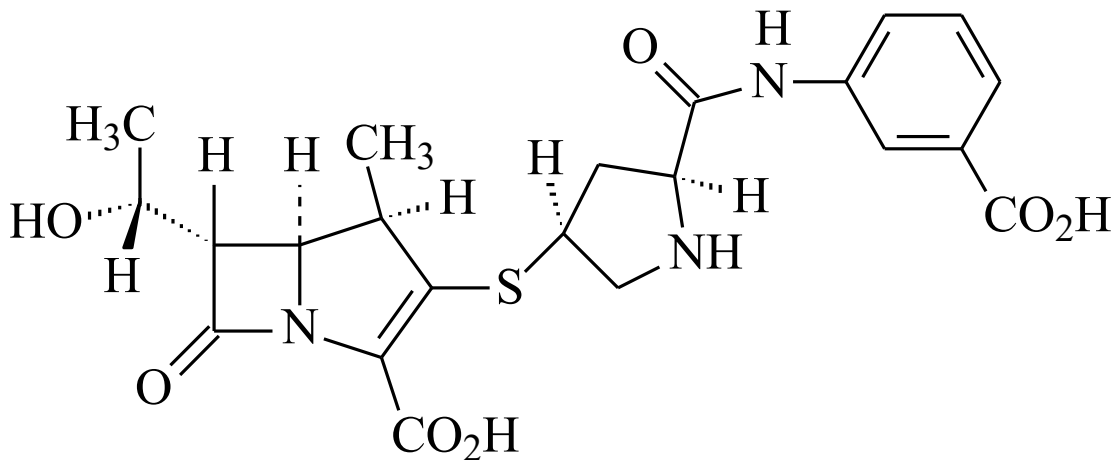
Αναστολέας νεφρικής  
δεϋδροπεπτιδάσης-1



meropenem

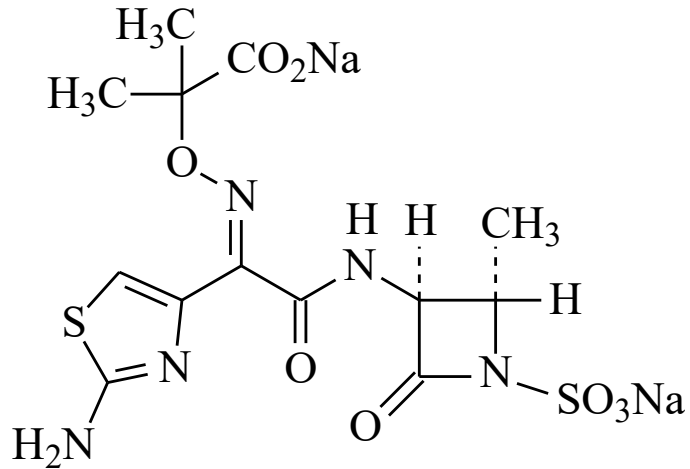
Το 4-CH<sub>3</sub> αποτρέπει την υδρόλυση από τη νεφρική δεϋδροπεπτιδάση-1 και έτσι μπορεί να χορηγηθεί ως μονοθεραπεία σε σοβαρές λοιμώξεις.

Σε σύγκριση με τα υπόλοιπα έχει μεγάλο  $t_{1/2}$  και μπορεί να χορηγηθεί 1 φορά/ημέρα, αλλά χρειάζεται προσοχή γιατί είναι αδρανές έναντι ψευδομονάδων και ακινητοβακτηρίων.



ertapenem

## Μονομπακτάμες



aztreonam

Το α-CH<sub>3</sub> προσφέρει σταθερότητα έναντι β-λακταμασών

Η αμινοσουλφονική ομάδα είναι ισχυρός ηλεκτρονιοδέκτης, έτσι αυξάνεται η δραστηριότητα της β-λακτάμης

Χρησιμοποιείται παρεντερικά, σχεδόν αποκλειστικά έναντι Gram-νοσοκομειακών στελεχών (ουροποιητικού, ανώτερου αναπνευστικού, οστών, γυναικολογικές μολύνσεις).

Δεν αναφέρεται συχνά διασταυρούμενη αντοχή με άλλα β-λακταμικά αντιβιοτικά.

