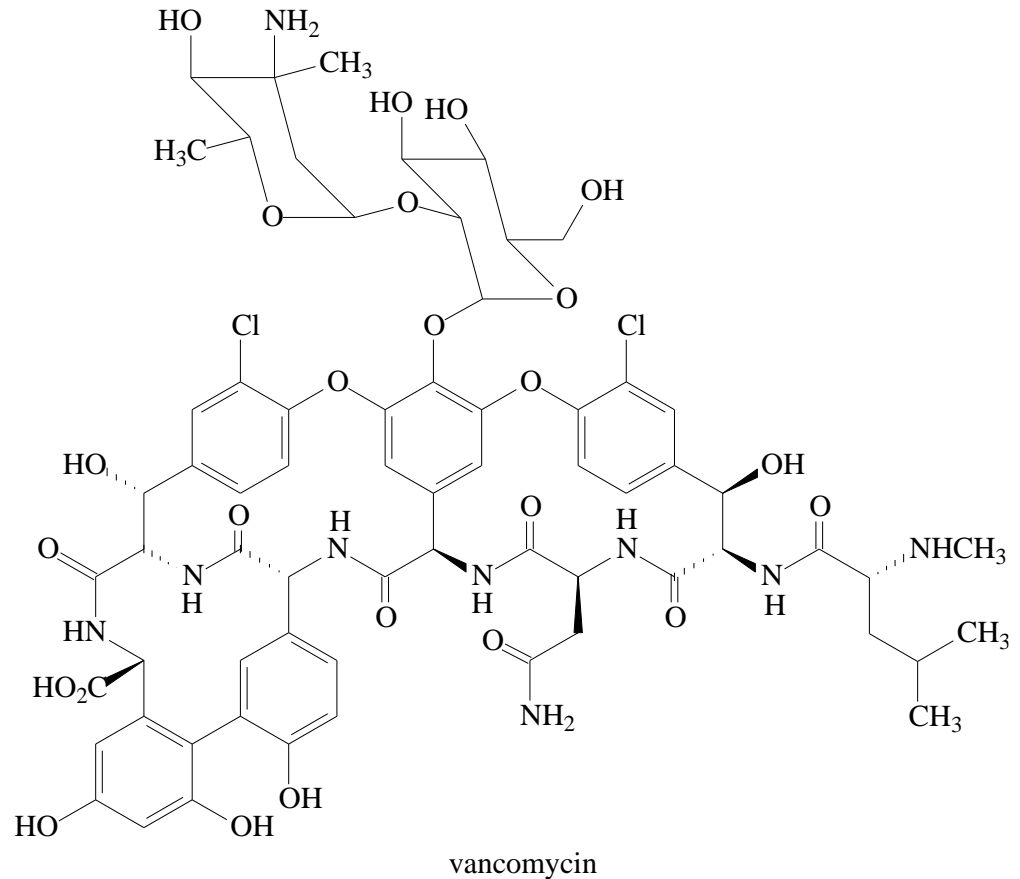


Γλυκοπεπτιδικά αντιβιοτικά

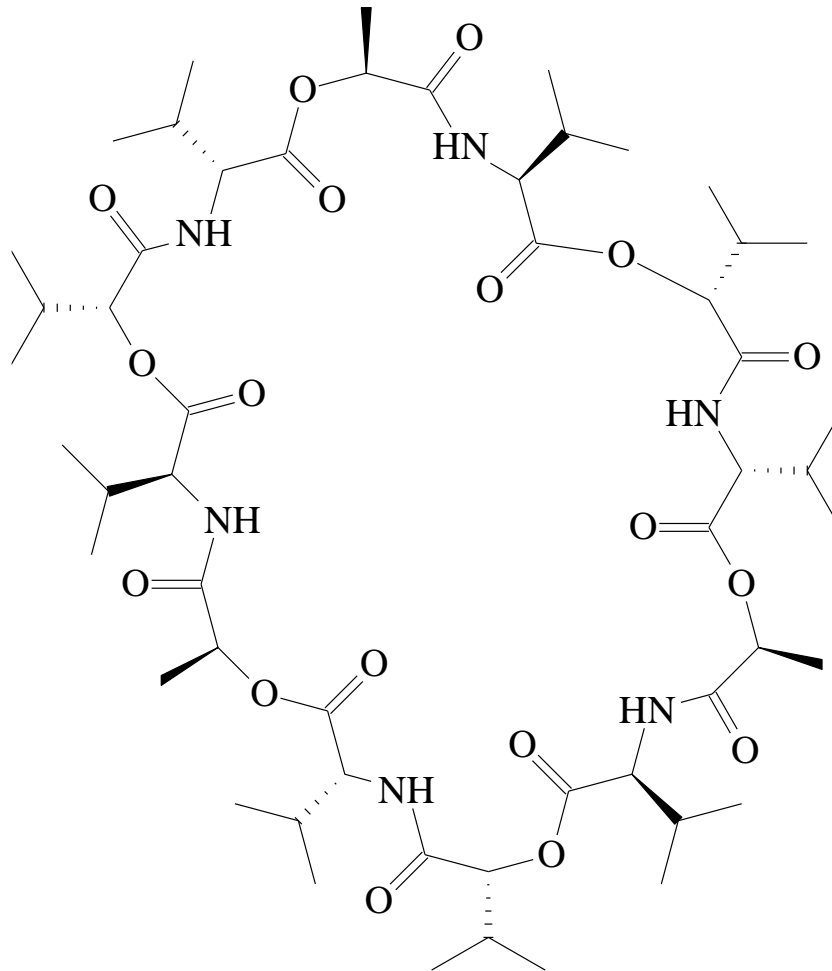
Αναστέλλει trans-γλυκολάσες
και trans-πεπτιδάσες

Ενσωματώνεται στις βακτηριακές
κυτταρικές μεμβράνες και
αναστέλλεται ο σχηματισμός του
βακτηριακού τοιχώματος
Σπάνια αναπτύσσεται βακτηριακή
αντοχή

Δρα έναντι Gram+ και
MRSA.
Ενδοφλέβια χορήγηση
αλλά έχει τοξικότητα



Αντιβιοτικά που δρουν επί της κυτταρικής μεμβράνης και μεταφέρουν ιόντα



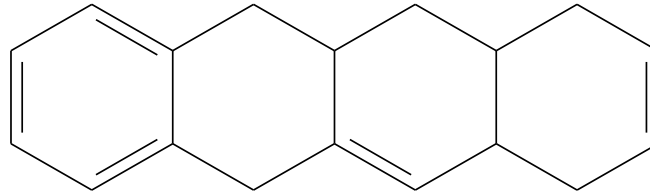
valinomycin A

Περικλείει και μεταφέρει ιόντα K^+ στο εσωτερικό του κυττάρου.

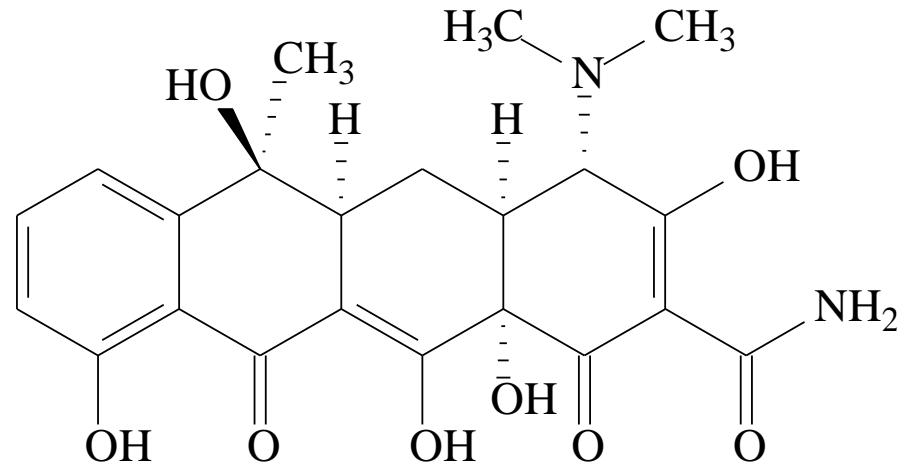
Δεν έχει εκλεκτικότητα στα βακτηριακά κύτταρα και έτσι είναι τοξικό.

Αντιβιοτικά που δρουν επί της βακτηριακής πρωτεϊνοσύνθεσης (αναστολείς της 30S ριβοσωμικής υπομονάδας)

Τετρακυκλίνες



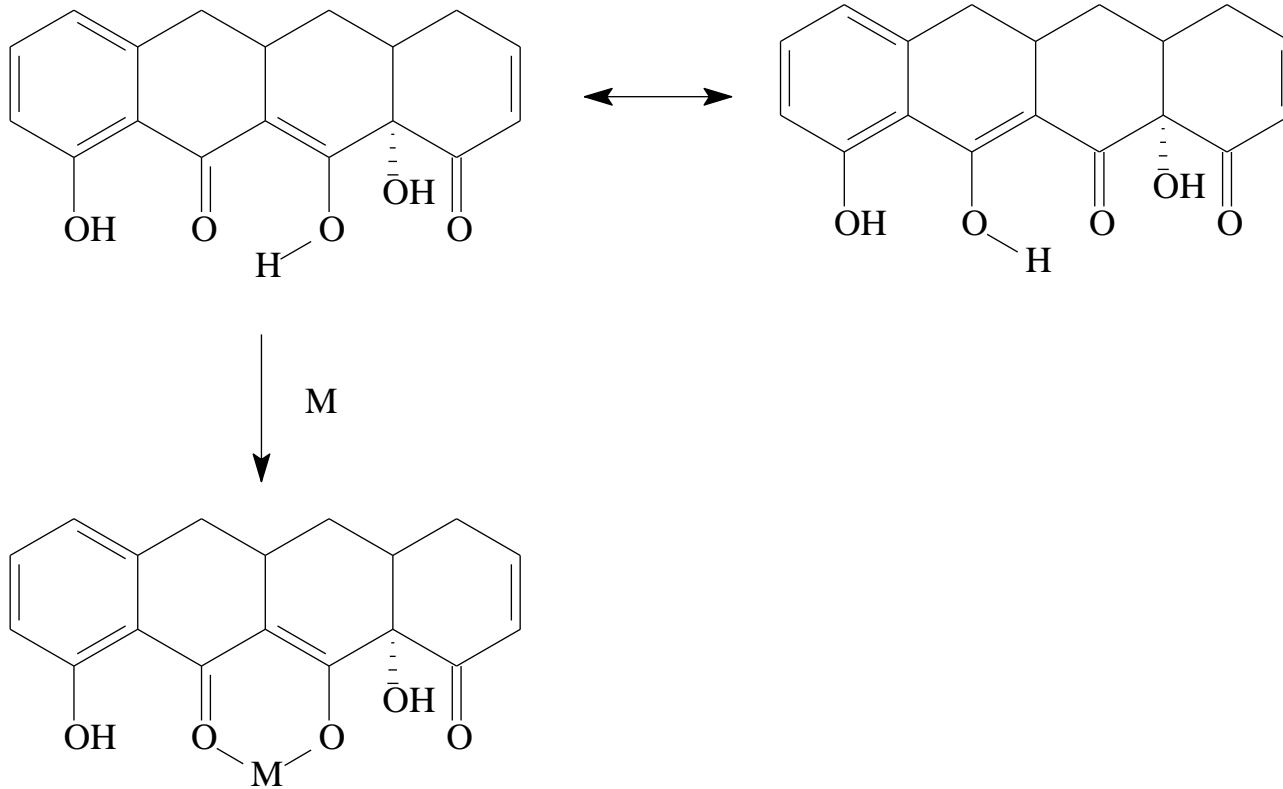
Έχουν **ευρύ αντιμικροβιακό φάσμα** αλλά αναπτύσσεται συχνά **αντοχή** με αποτέλεσμα την περιορισμένη χρήση τους.



tetracycline

Χορηγούνται από το στόμα, ή παρεντερικά, κυρίως IM, γιατί IV μπορεί να προκαλέσουν θρομβοφλεβίτιδα.

Δημιουργία συμπλόκων

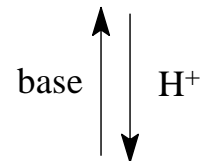
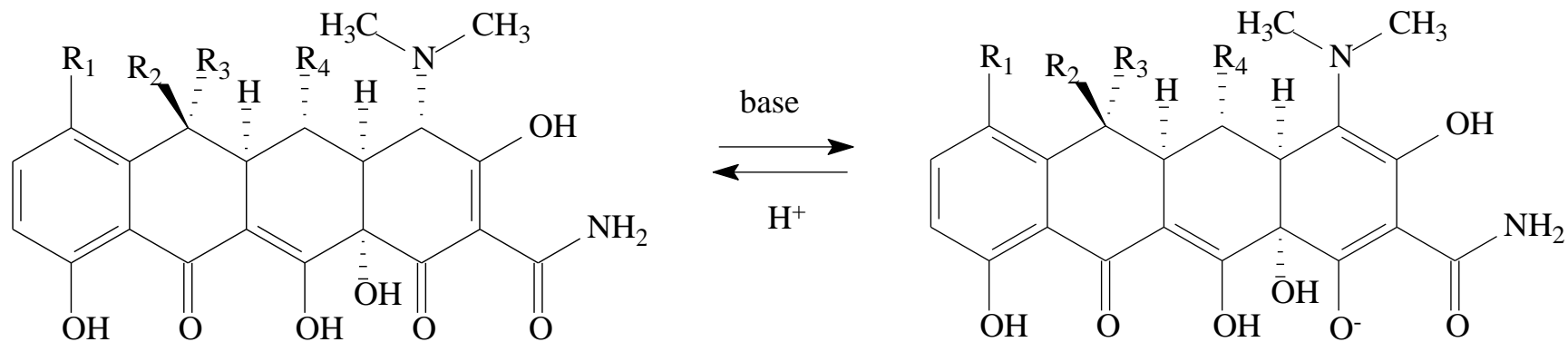


Προσοχή κατά τη χορήγηση παρουσία δι- ή τρισθενών ιόντων (αντιόξινα, γαλακτοκομικά).

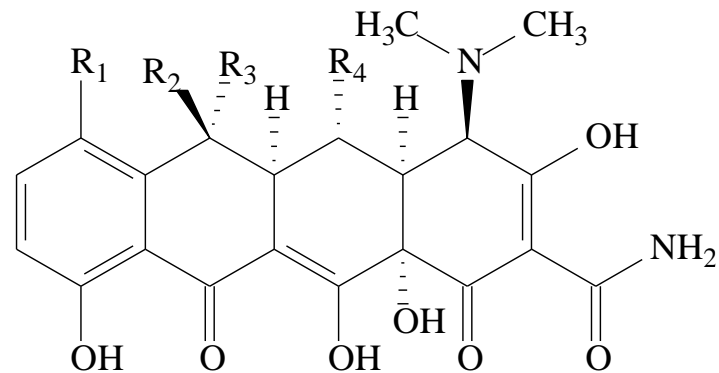
Συσσωρεύονται σε οστά και δόντια (πλούσια σε Ca^{2+})

Πόνος κατά την IM ένεση.

Αδρανοποίηση κατά την επιμερείωση τετρακυκλινών

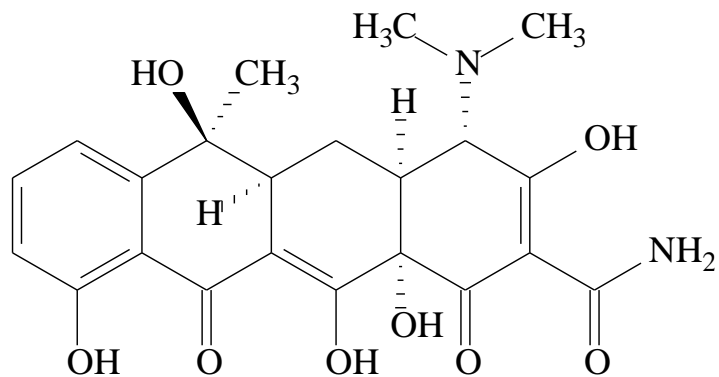


Αδρανές επιμερές

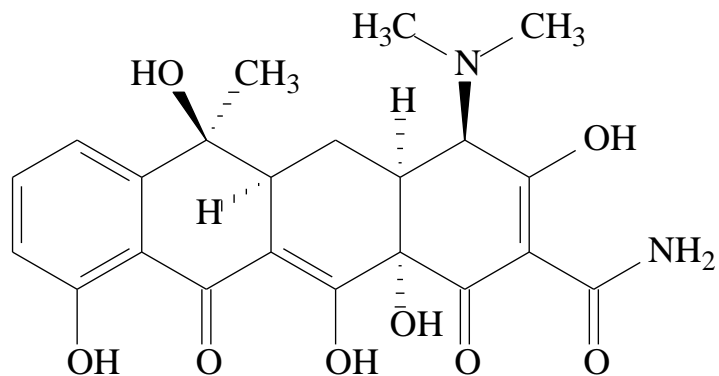
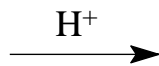
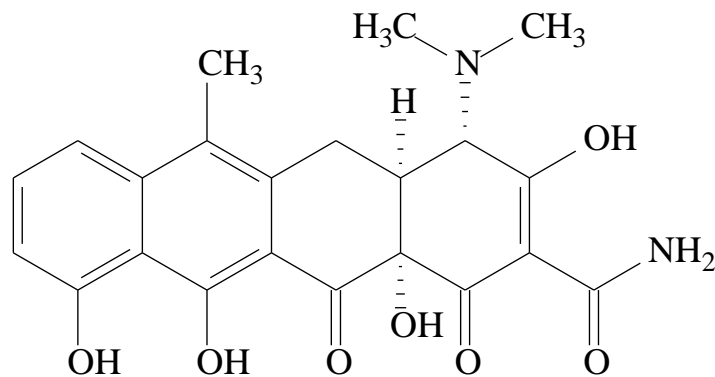


Τετρακυκλίνες με βενζυλικό OH σε όξινο περιβάλλον

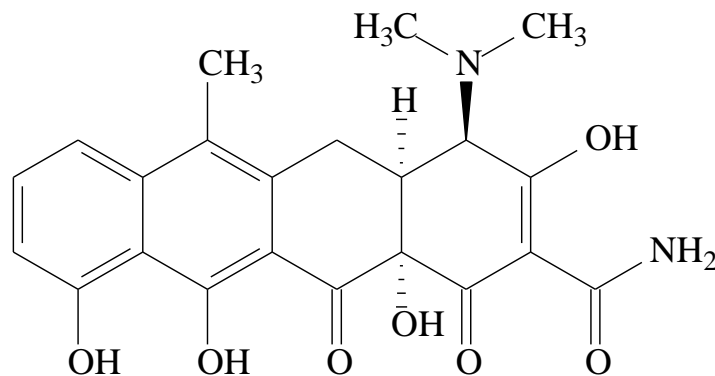
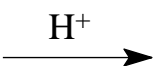
τετρακυκλίνη δραστική



ανυδροτετρακυκλίνη αδρανής



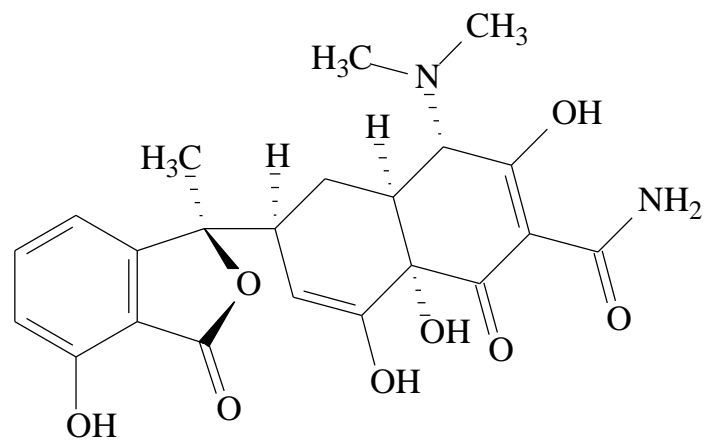
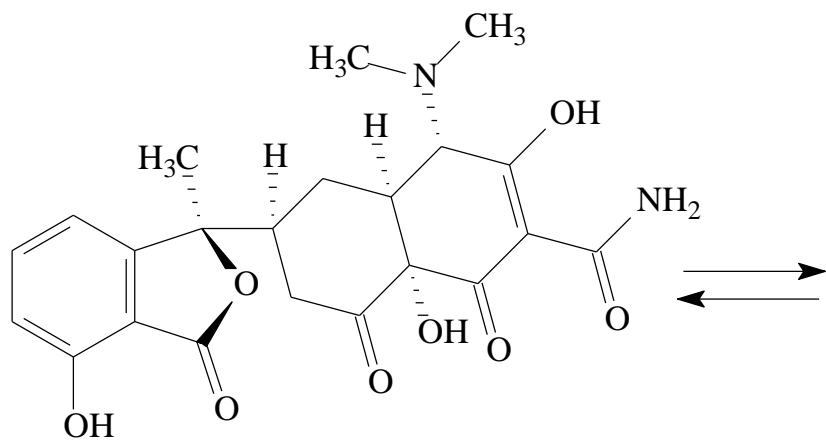
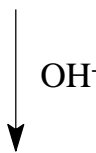
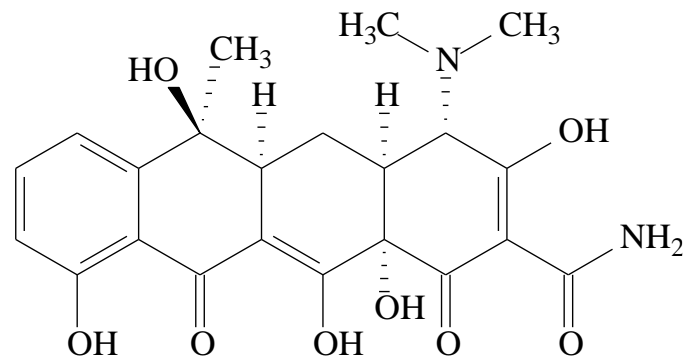
4-επιτετρακυκλίνη αδρανής



4-επιανυδροτετρακυκλίνη αδρανής

Σημαντική νεφροτοξικότητα

Τετρακυκλίνες με βενζυλικό OH σε αλκαλικό περιβάλλον

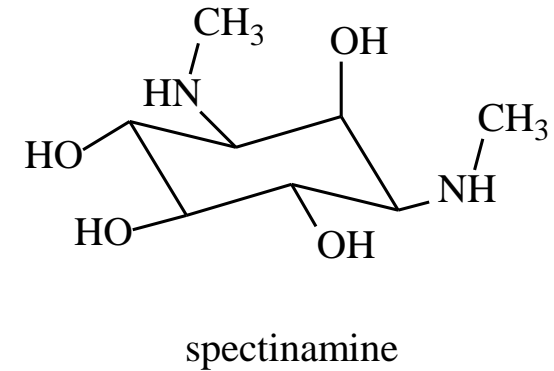
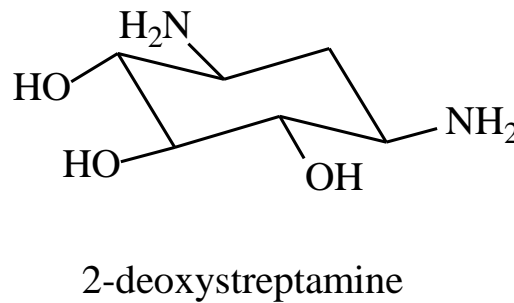
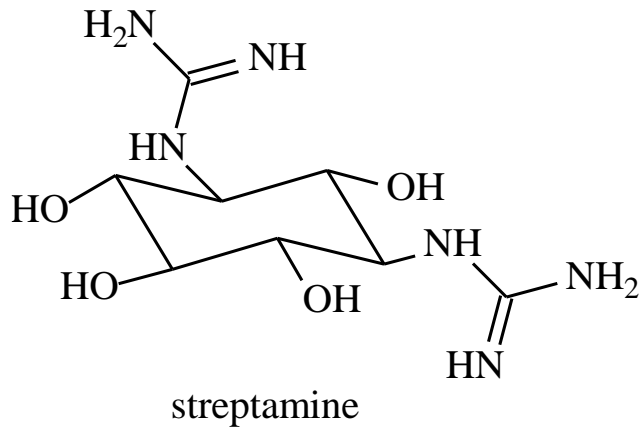


αδρανές

Αντιβιοτικά που δρουν επί της βακτηριακής πρωτεϊνοσύνθεσης (αναστολείς της 30S ριβοσωμικής υπομονάδας)

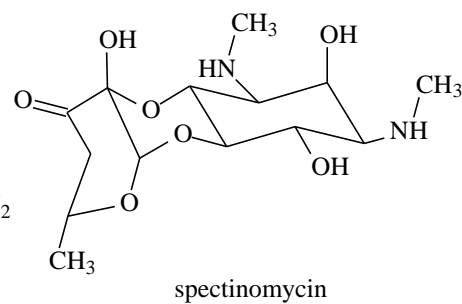
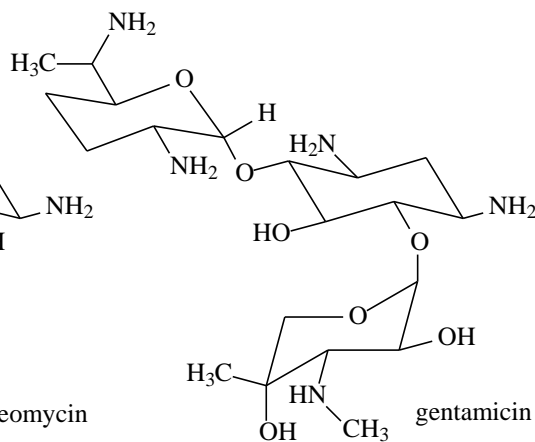
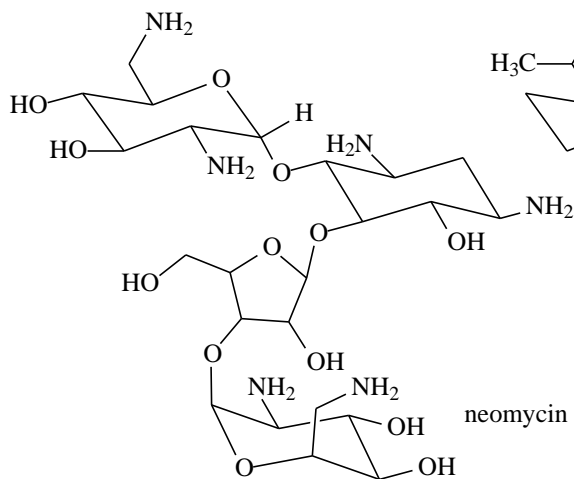
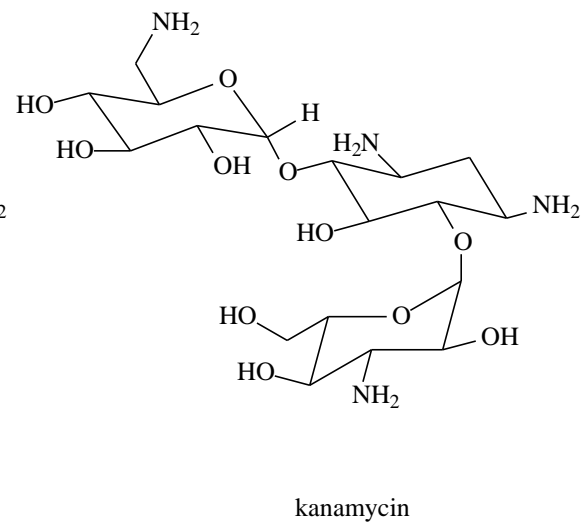
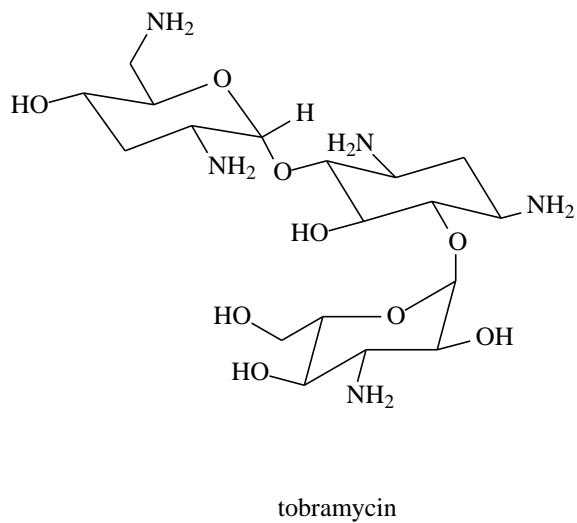
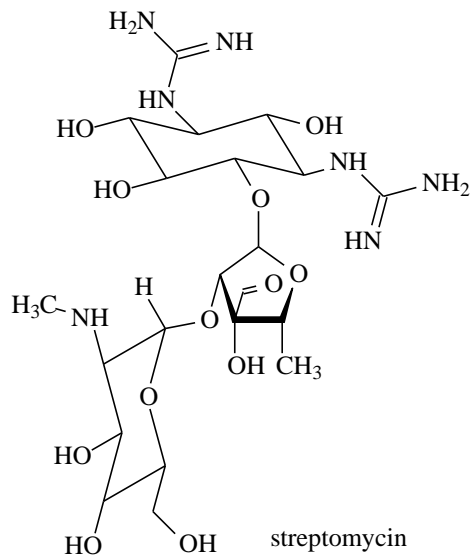
Αμινογλυκοζίδες

Χαρακτηρίζονται από τρεις διαφορετικούς υποκατεστημένους δακτυλίους. Οι υδροξυλομάδες υποκαθίστανται μέσω γλυκοζιτικών δεσμών με αμινοσάκχαρα και έτσι σχηματίζονται ψευδο-ολιγοσακχαρίτες.



Συνδέονται στα ριβοσώματα και προκαλούν **εσφαλμένη αλληλουχία** αμινοξέων προς σχηματισμό **ανενεργών πρωτεϊνών**.

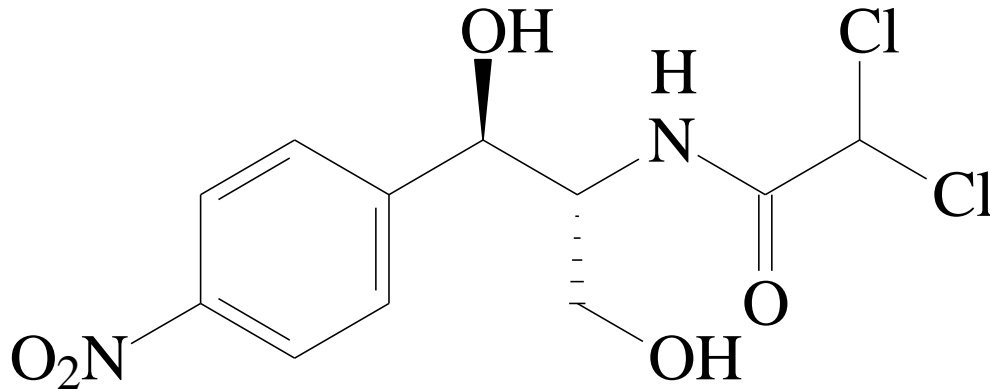
Είναι ευρέος φάσματος, αλλά **δεν χρησιμοποιούνται ευρέως**, παρά **μόνο σε σοβαρές Gram- μολύνσεις** λόγω ωτοτοξικότητας και νεφροτοξικότητας



δομές ορισμένων χαρακτηριστικών αμινογλυκοζιτών

Αντιβιοτικά που δρουν επί της βακτηριακής πρωτεϊνοσύνθεσης (αναστολείς της 50S ριβοσωμικής υπομονάδας)

Χλωραμφενικόλη



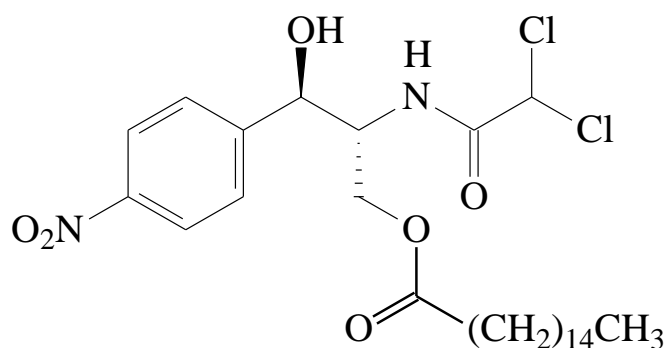
Μόνο το ένα (1R,2R) από τα 4 διαστερεομερή είναι δραστικό (threo-ισομερές ή anti-)

Η χλωραμφενικόλη αναστέλλει την πεπτιδυλοτρανσφεράση με αποτέλεσμα να μην δημιουργείται ο νέος πεπτιδικός δεσμός.

Ευρέος φάσματος, χορηγούμενο από το στόμα, αλλά μυελοτοξικό (απλαστική αναιμία).

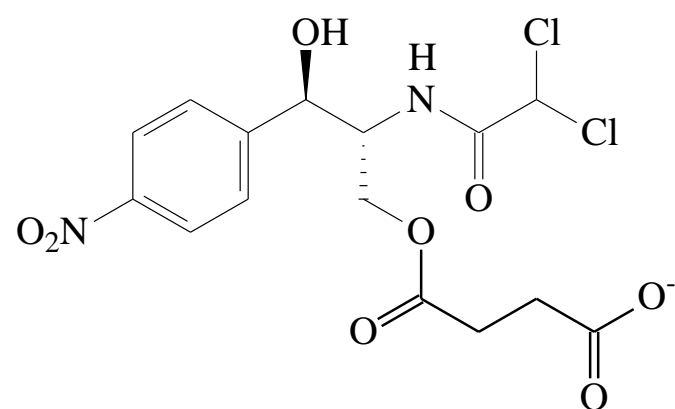
Αναπτύσσεται αντοχή λόγω ακετυλίωσης του 2ταγούς (κυρίως) και 1ταγούς OH, οπότε δεν συνδέεται στα ριβοσώματα.

Προφάρμακα χλωραμφενικόλης



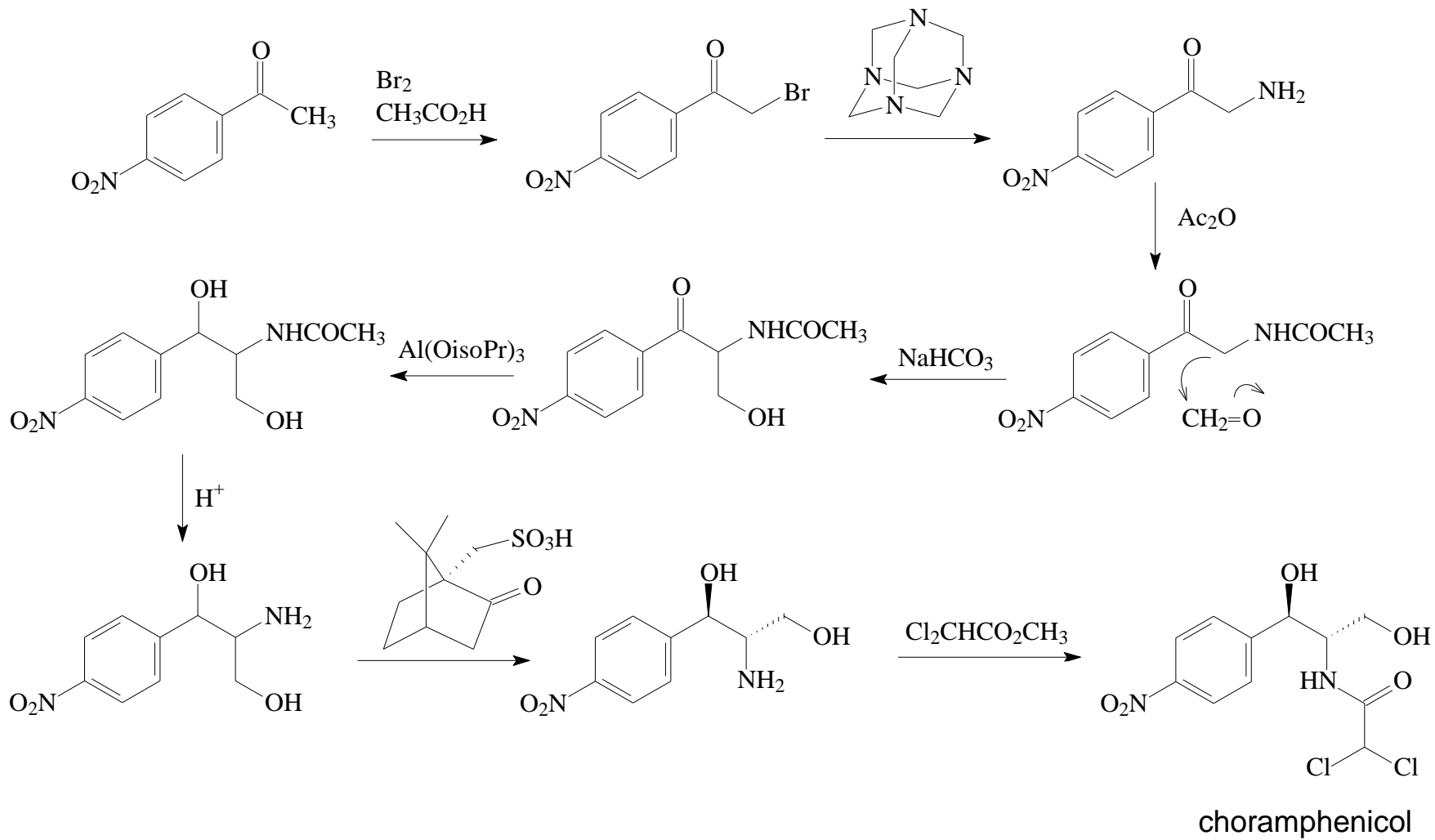
chloramphenicol palmitate

Βελτίωση της πικρής γεύσης,
υδρολύεται στον δωδεκαδάκτυλο,
χορήγηση per os



chloramphenicol hemisuccinate

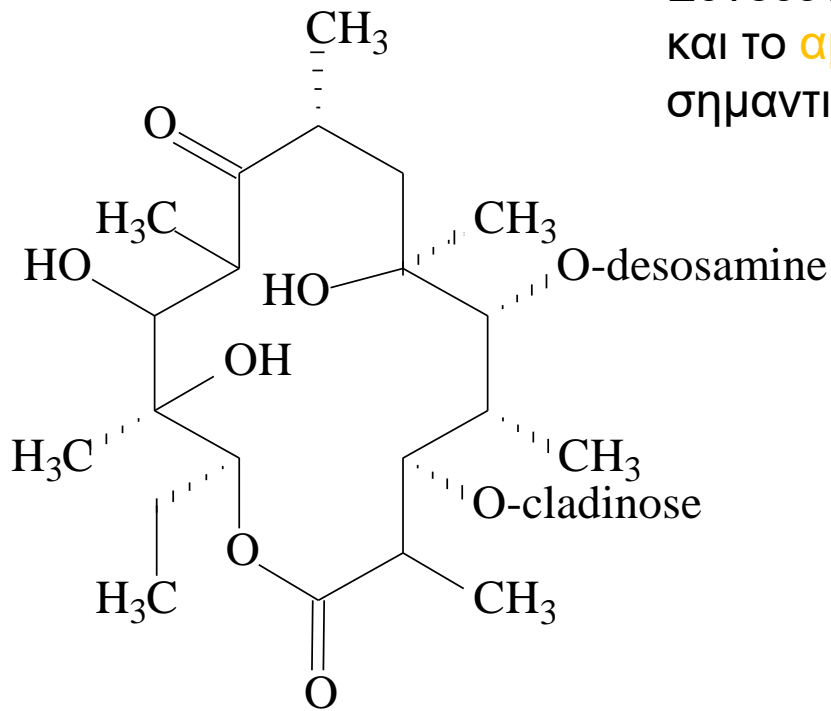
Βελτίωση της χαμηλής υδατοδιαλυτότητας,
χορήγηση IV



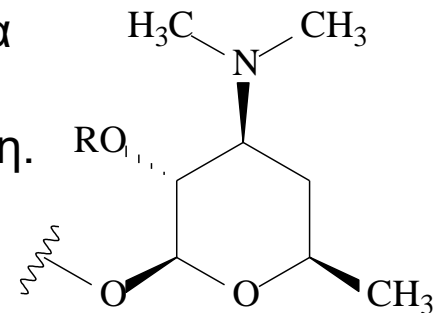
Αντιβιοτικά που δρουν επί της βακτηριακής πρωτεϊνοσύνθεσης (αναστολείς της 50S ριβωσωμικής υπομονάδας)

Μακρολίδια

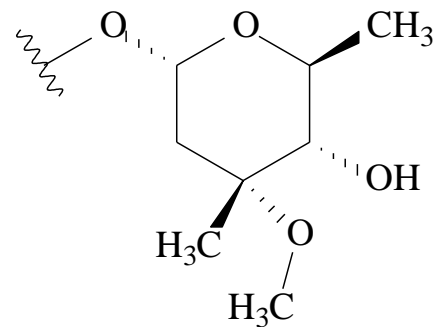
Συνδέονται στα ριβοσώματα και το **αμινοσάκχαρο** είναι σημαντικό για την πρόσδεση.



erythromycin



desosamine



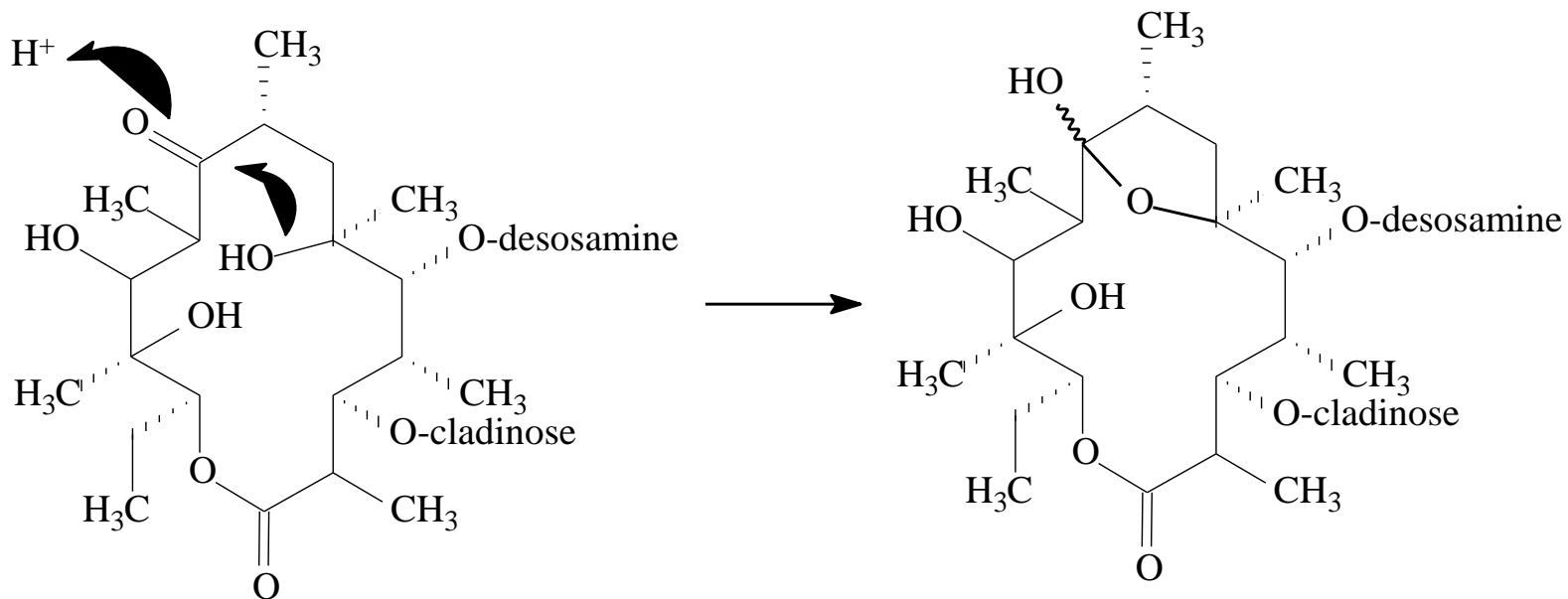
cladinose

Μέτρια υδατοδιαλυτότητα, αλλά σχηματίζουν άλατα.

Κυρίως έναντι **Gram+** μικροοργανισμών (per os).

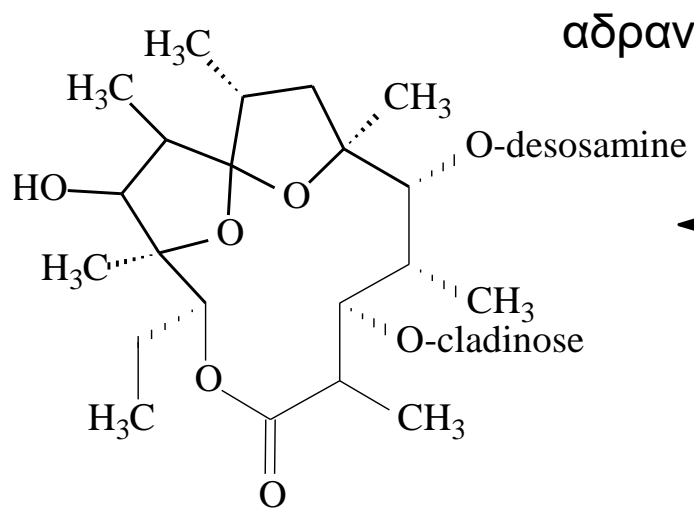
Συγκαταλέγονται μεταξύ των **ασφαλέστερων** αντιβιοτικών, **μη τοξικά** στον άνθρωπο

Ανθεκτικά βακτηριακά στελέχη έχουν τροποποιημένο rRNA ή αναπτύσσουν μηχανισμούς απέκκρισης

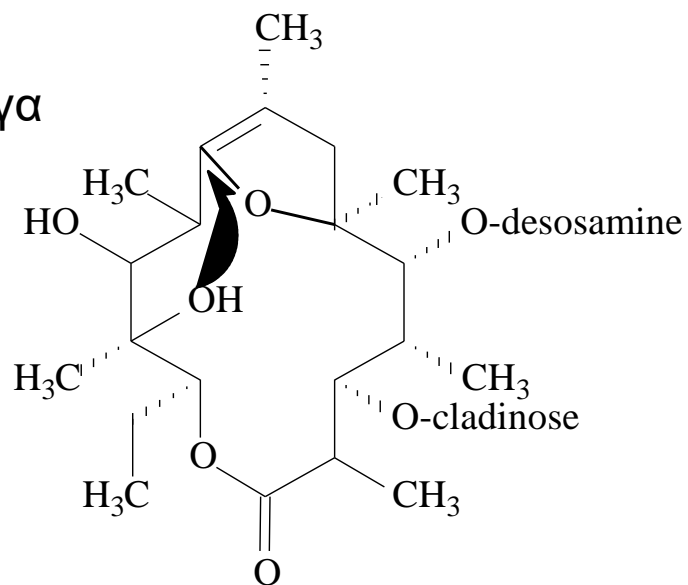


Πρόνοια ώστε να χορηγούνται σε επικαλυπτόμενα δισκία

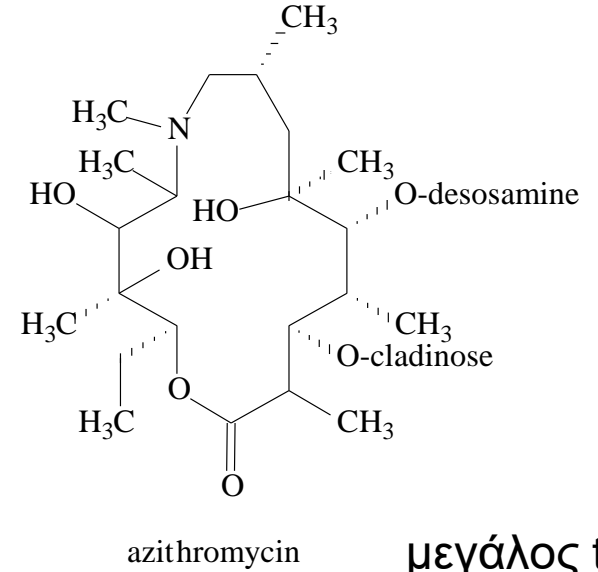
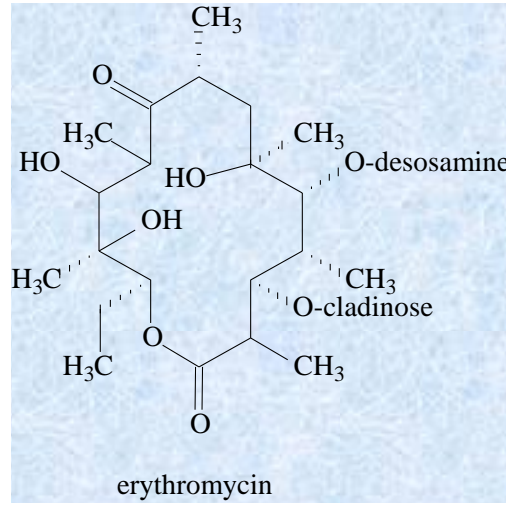
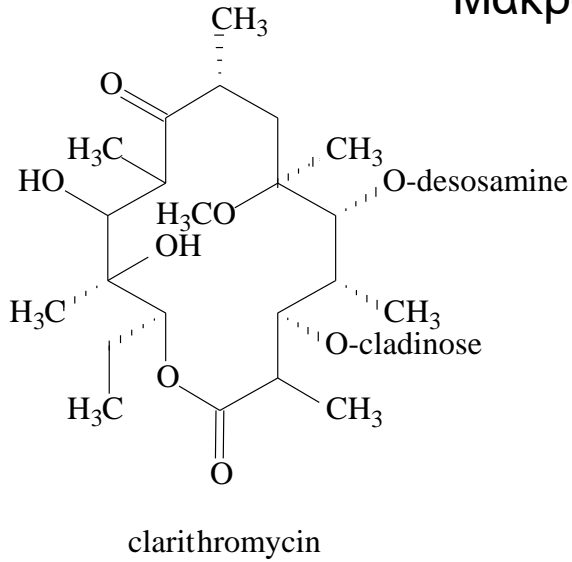
$-\text{H}_2\text{O}$



αδρανή παράγωγα

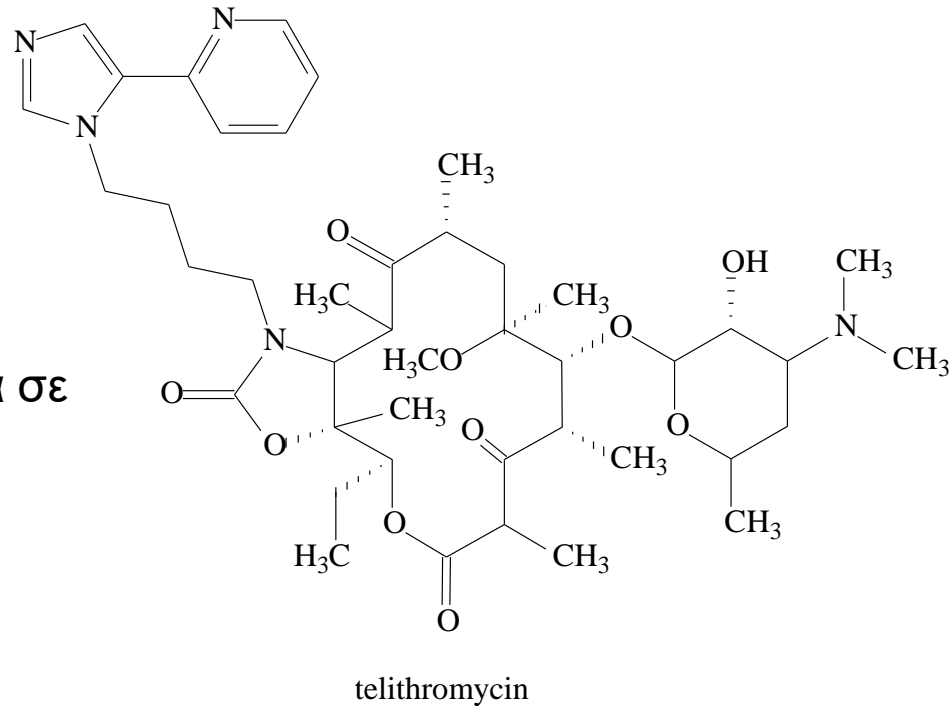


Μακρολίδια σταθερά σε όξινο περιβάλλον



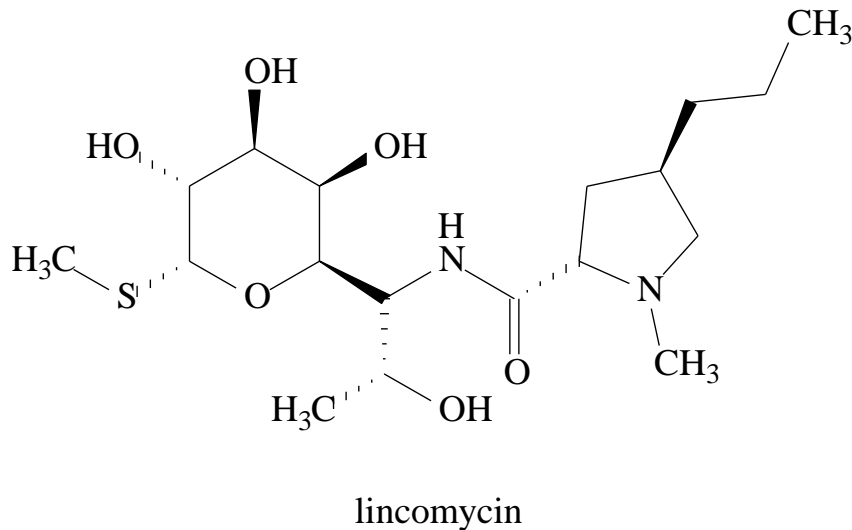
μεγάλος $t_{1/2}$

«κετολίδιο»: οξείδωση του C-3.
Δραστικό σε βακτήρια ανθεκτικά σε erythromycin

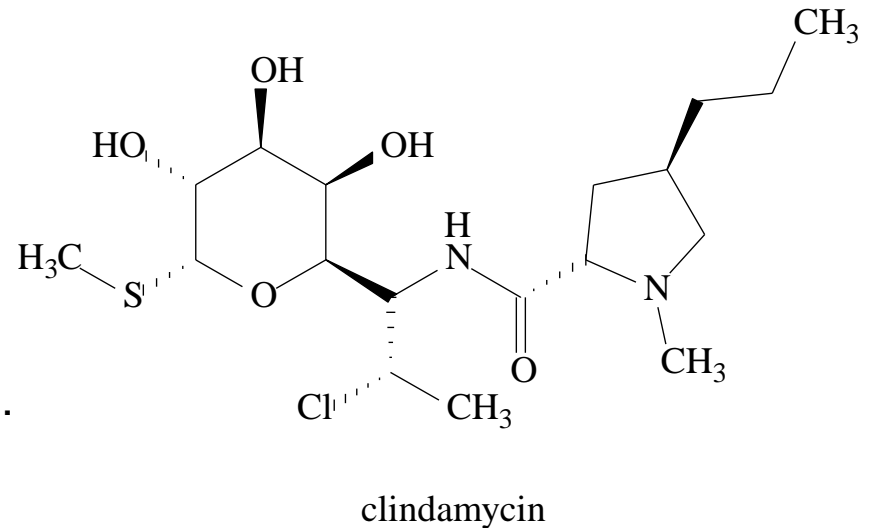


Αντιβιοτικά που δρουν επί της βακτηριακής πρωτεϊνοσύνθεσης (αναστολείς της 50S ριβοσωμικής υπομονάδας)

Λινκοζαμίδια



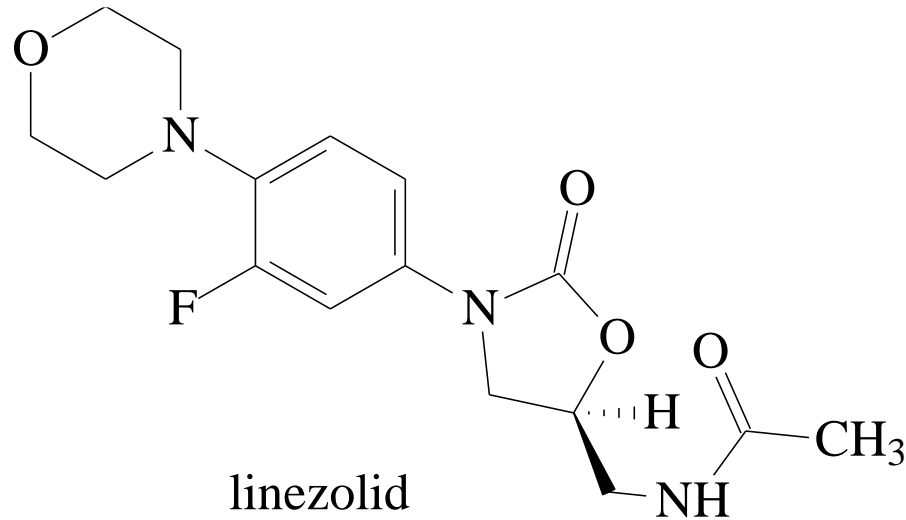
Έχουν **παρόμοιο** μηχανισμό δράσης με τα μακρολίδια, συνδέονται σε **ανάλογη** περιοχή του rRNA και μπορεί να εμφανίσουν **διασταυρούμενη** αντοχή.



Σε σοβαρές μολύνσεις από Gram+ βακτήρια.
Σε ασθενείς αλλεργικούς στα β-λακταμικά.

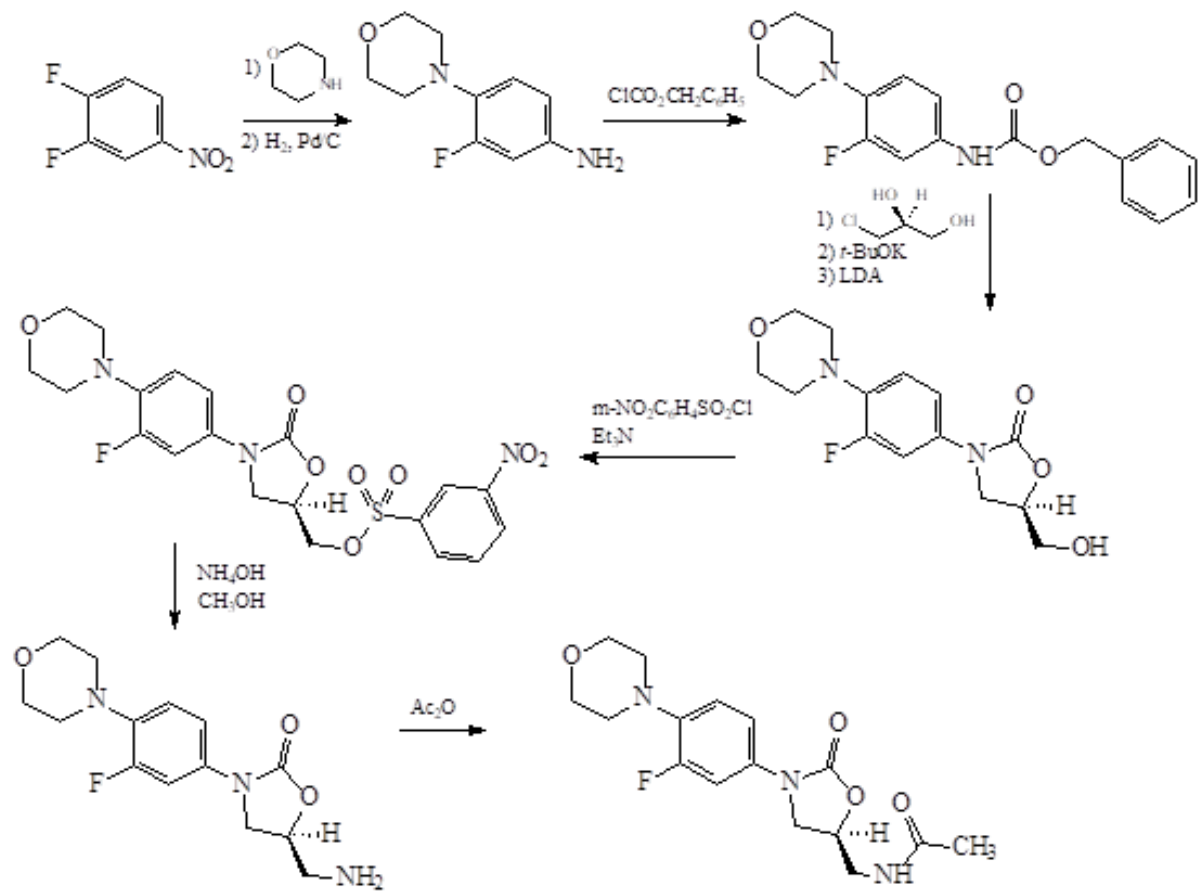
Διευκόλυνση απορρόφησης,
χορηγούμενο per os

Αντιβιοτικά που δρουν σε πρώιμα στάδια της βακτηριακής πρωτεϊνοσύνθεσης (επί της 50S ριβοσωμικής υπομονάδας)



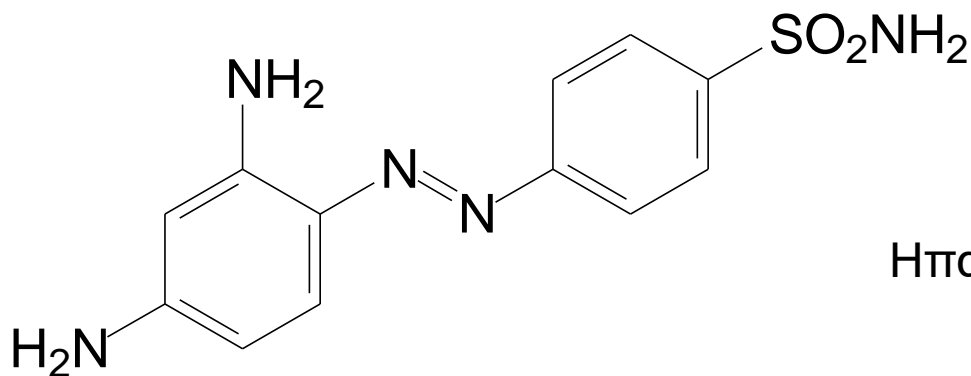
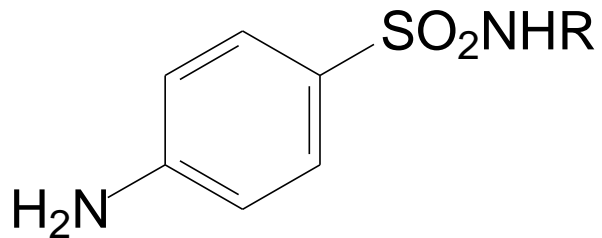
Δρα έναντι Gram+ βακτηρίων ακόμη και επί ανθεκτικών στελεχών (per os χορήγηση)

Αναπτύσσεται αντοχή λόγω μεταλλάξεων της 23S rRNA υπομονάδας.
Gram- στελέχη είναι ανθεκτικά γιατί διαθέτουν αντλίες απέκκρισης.

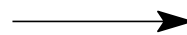


Φάρμακα που επηρεάζουν τη σύνθεση νουκλεϊνικών οξέων

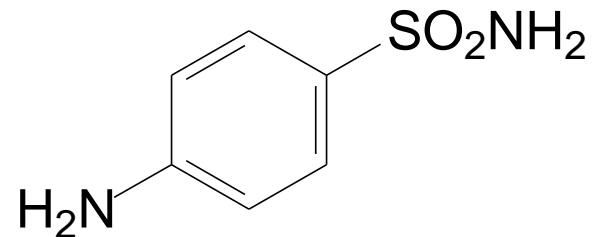
Σουλφοναμίδια



prontosil rubrum

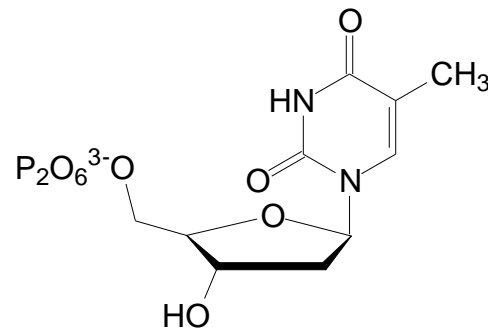
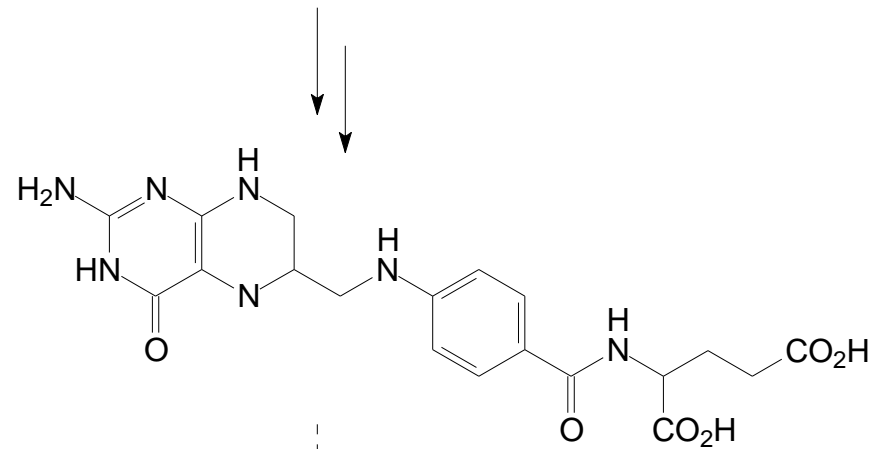
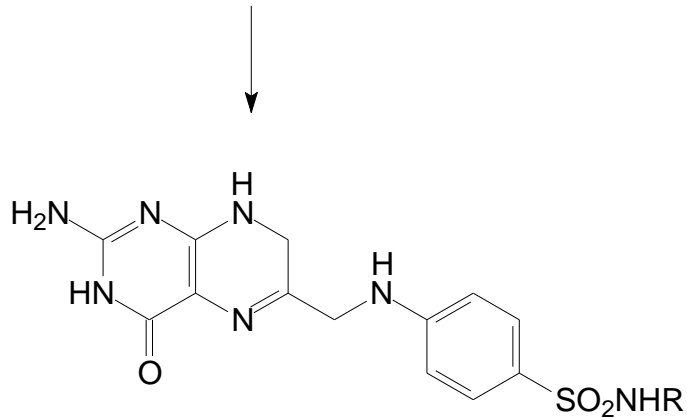
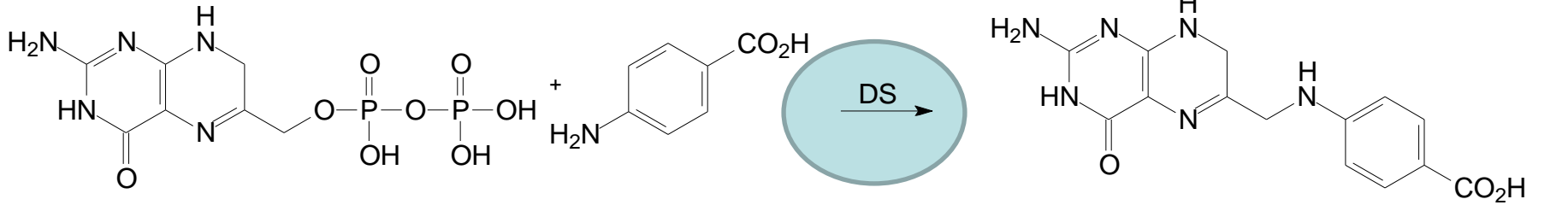


Ηπατικά ένζυμα



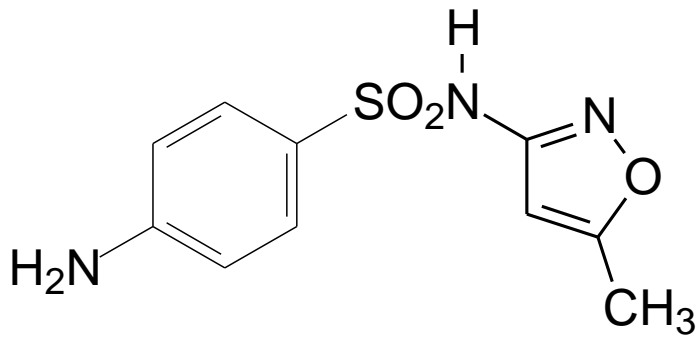
Αναστολή

Dihydropterate Synthase



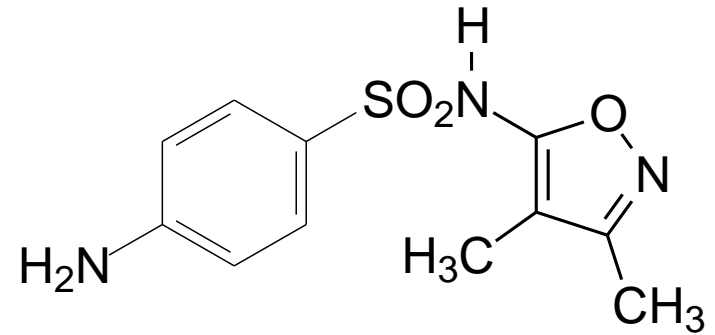
DNA

Βακτήρια που προσλαμβάνουν το
φολικό οξύ είναι ανθεκτικά στα
σουλφοναμίδια

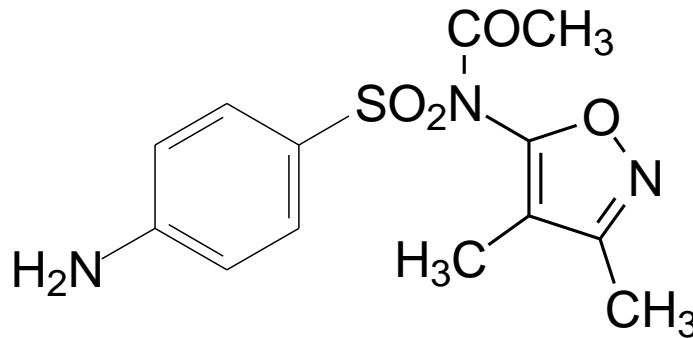


sulfamethoxazole

Συνδυασμός με trimethoprim,
κυρίως για μολύνσεις ουροποιητικού



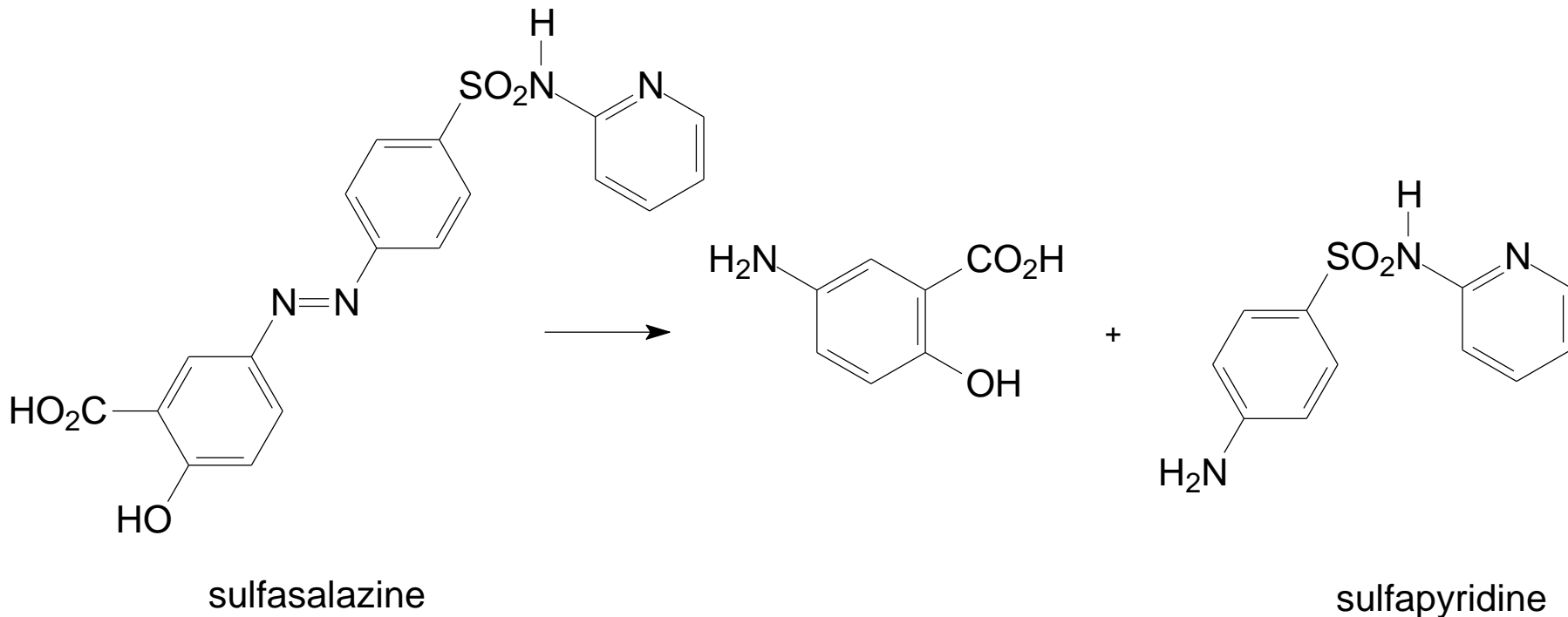
sulfisoxazole



sulfisoxazole acetyl

Συνδυασμός με erythromycin

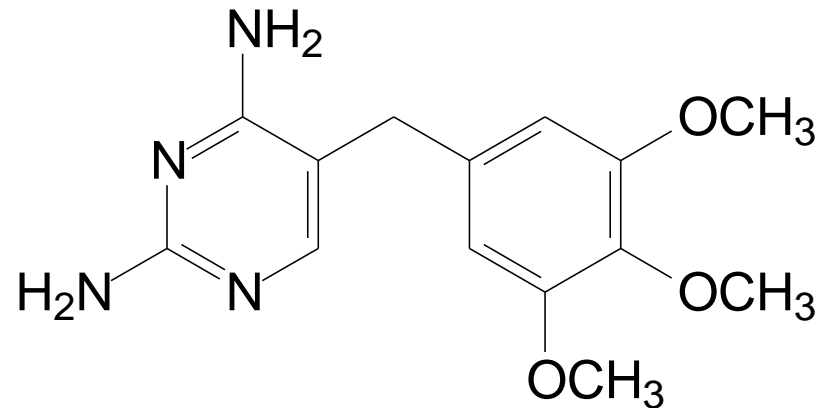
Ευρέος φάσματος, κυρίως
έναντι Gram-, όμως
περιορισμένης εφαρμογής
λόγω ανάπτυξης ανθεκτικών
στελεχών.



Τα σουλφοναμίδια μπορεί να προκαλέσουν αλλεργικές αντιδράσεις και σπανιότερα νεφροτοξικότητα και ηπατοτοξικότητα. Η σημαντικότερη αλλά σπάνια παρενέργειά τους είναι το σύνδρομο Stevens-Johnson (έλκη σε οφθαλμούς, στόμα, ουρήθρα).

Φάρμακα που επηρεάζουν τη σύνθεση νουκλεϊνικών οξέων

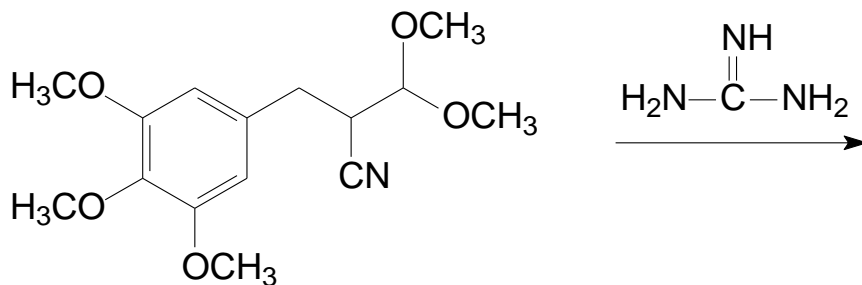
trimethoprim



Χρησιμοποιείται ως μονοθεραπεία για την από του στόματος αντιμετώπιση απλών λοιμώξεων των ουροφόρων οδών.

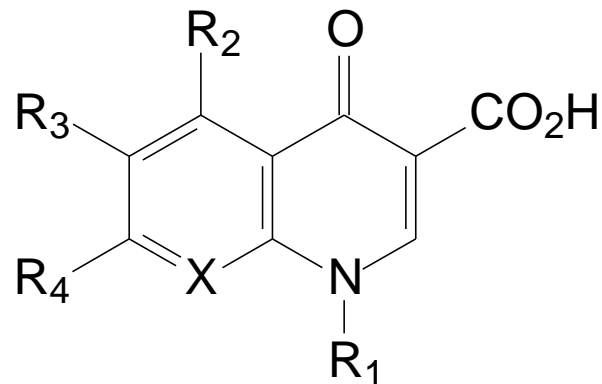
Αναπτύσσονται όμως συχνά ανθεκτικά στελέχη. Για τον λόγο αυτό συγχορηγείται με sulfamethoxazole.

Αναστέλλει τη διϋδροφολλική αναγωγή (DHFR) κυρίως των βακτηριακών ενζύμων και ελάχιστα των αντίστοιχων των θηλαστικών

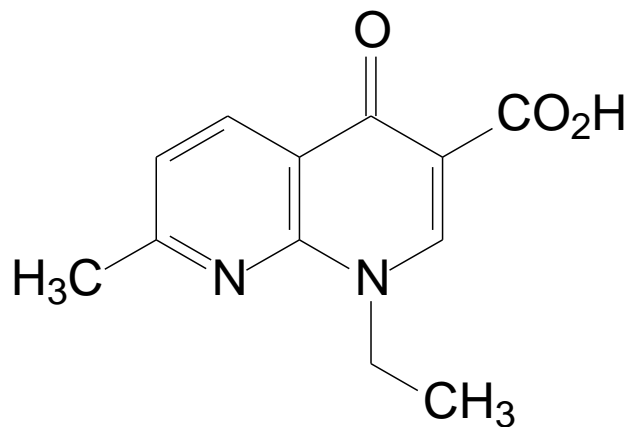


Φάρμακα που επηρεάζουν τη σύνθεση νουκλεϊνικών οξέων

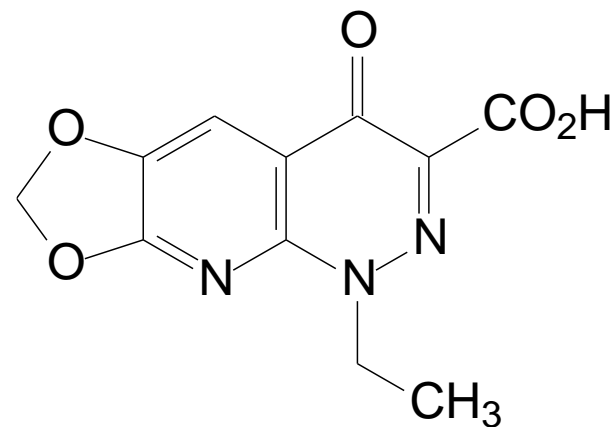
Κινολόνες



1^{ης} γενιάς



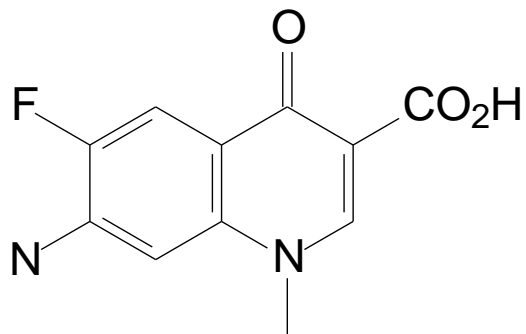
Nalidixic acid



Cinoxacin

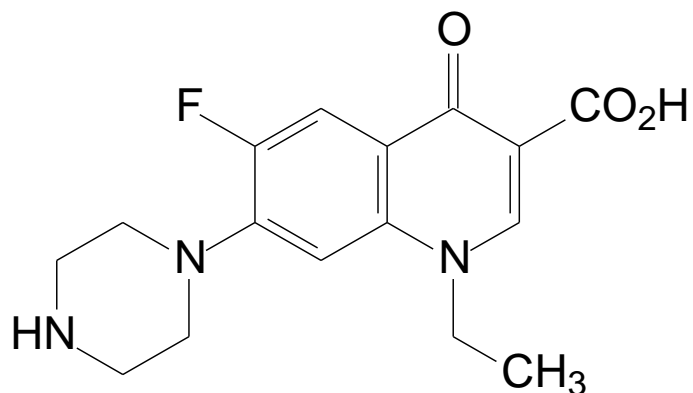
Σήμερα, περιορισμένης χρήσης έναντι μολύνσεων του ουροποιητικού από ορισμένα Gram-

Φθοροκινολόνες

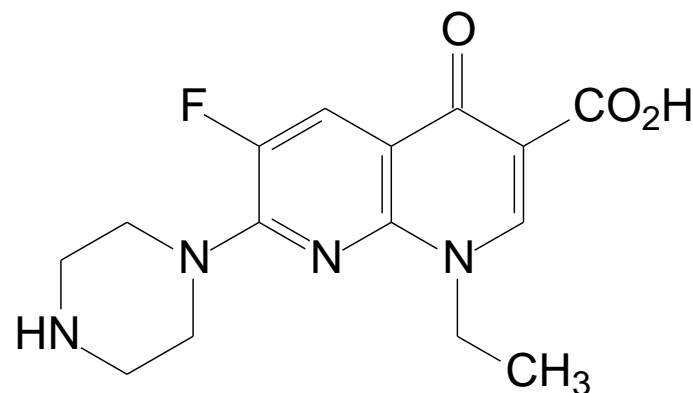


καλή απορρόφηση,
βιοδιαθεσιμότητα,
μεγάλος t1/2

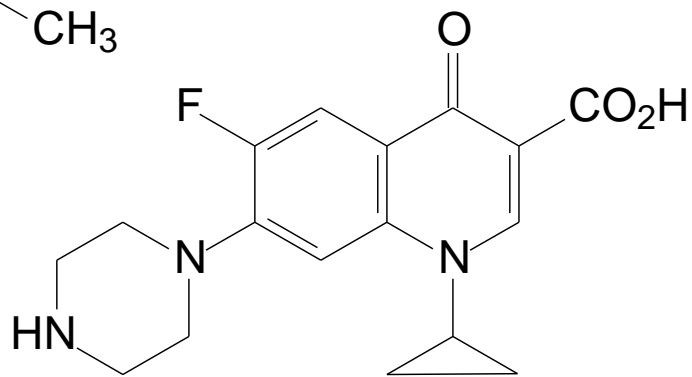
2ης γενιάς Μολύνσεις ουροποιητικού, άνω αναπνευστικού, οστών,
ενδοκαρδίτιδες, μηνιγγίτιδες, σεξουαλικά μεταδιδόμενες.



norfloxacin

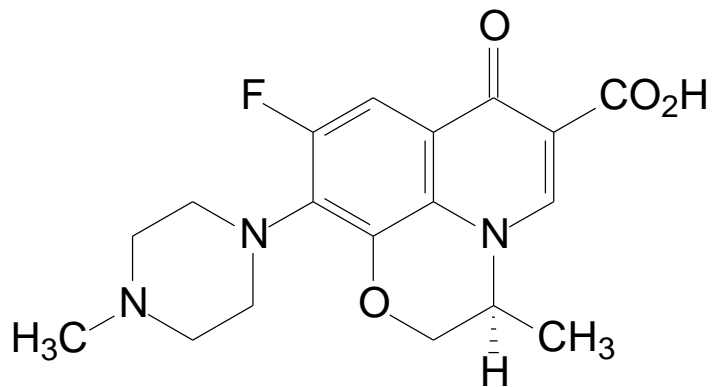


enoxacin

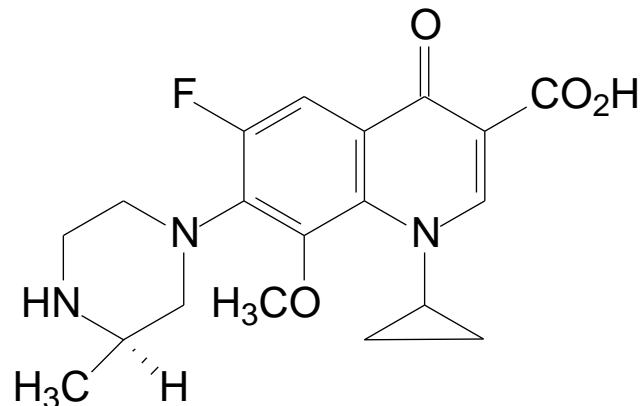


ciprofloxacin

3^{ης} γενιάς Οξείες βακτηριακές λοιμώξεις, χρόνιες βρογχίτιδες, πνευμονία

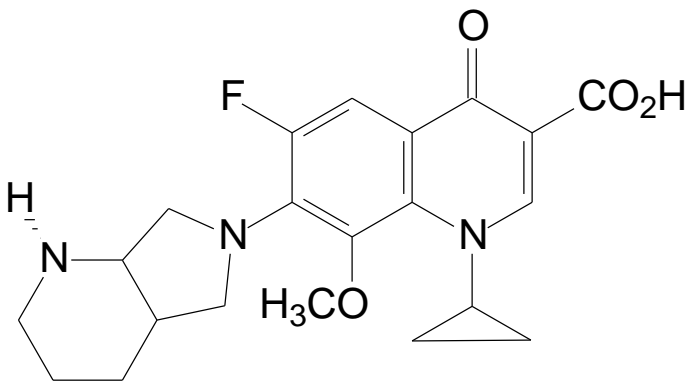


levofloxacin (3S)

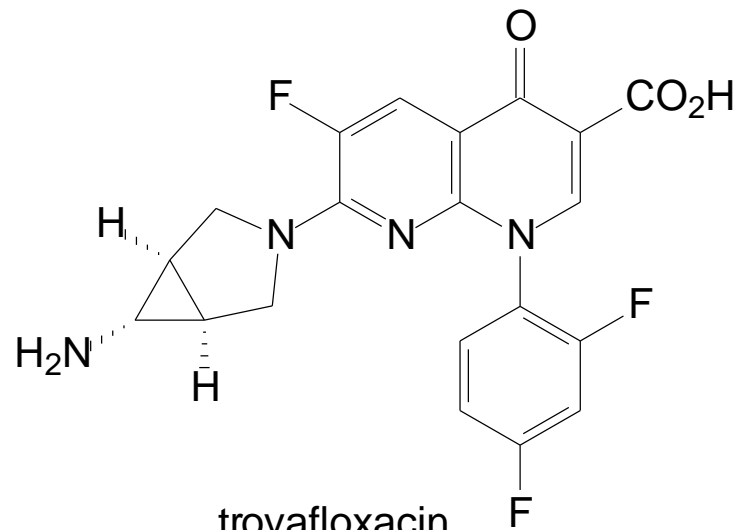


gatifloxacin

4^{ης} γενιάς Εύρος δράσης που περιλαμβάνει και αναερόβια μικρόβια

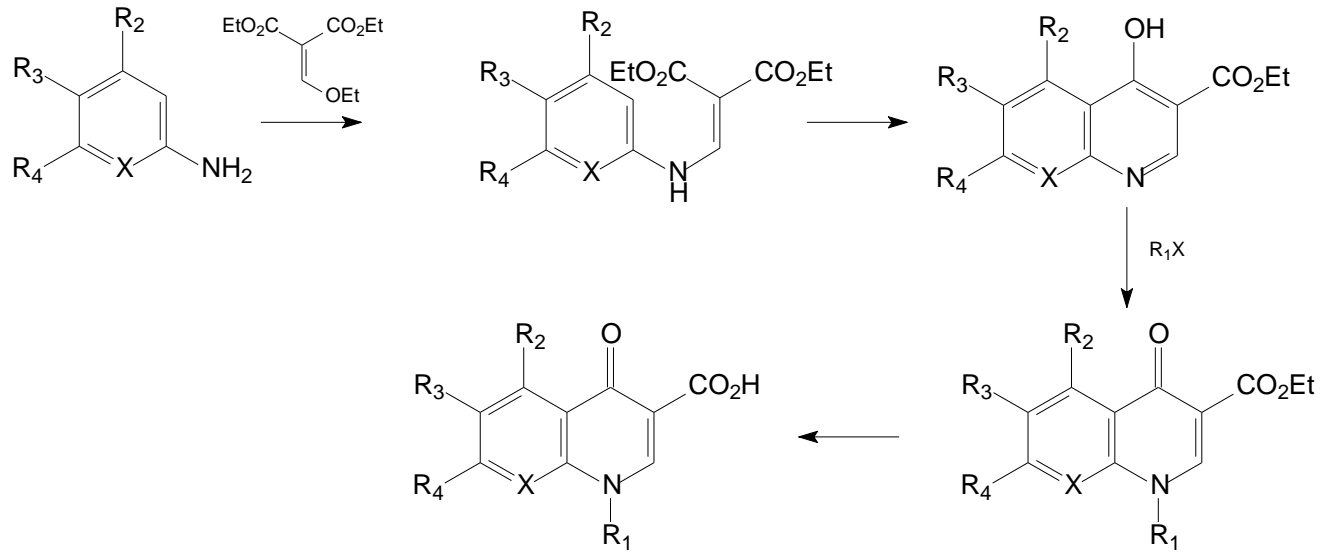


moxifloxacin



trovafloxacin

Μέθοδος σύνθεσης κινολονών από ανιλίνες



Μέθοδος σύνθεσης κινολονών από ακυλοχλωρίδια

