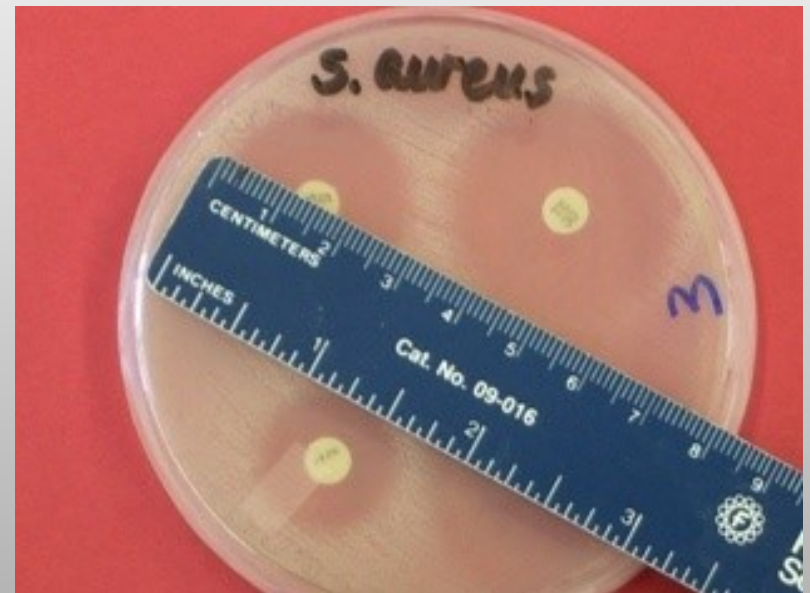


ANTIBIOTIKA



Τι είναι τα αντιβιοτικά;

- Ουσίες που αποτελούν φυσικά παράγωγα μικροοργανισμών και δρουν εναντίων άλλων μικροοργανισμών (αντι-βιοτικά)
- Σήμερα χρησιμοποιείται ο όρος «αντιμικροβιακά»
 - Φυσικά
 - Ημισυνθετικά (χημική τροποποίηση φυσικών)
 - Συνθετικά (χημειοθεραπευτικά)

- Αντιβιοτικό: Κάθε χημική ουσία που παράγεται από ένα μικροοργανισμό και αναστέλλει την ανάπτυξη άλλων μικροοργανισμών.
- Αντιμικροβιακός παράγων: Χημική ουσία που παράγεται ΕΙΤΕ από μικροοργανισμό ΕΙΤΕ από συνθετικά και αναστέλλει την ανάπτυξη των μικροβίων
- Χημικοθεραπευτικός παράγων: Αντιμικροβιακός παράγοντας ενάντια και σε ανθρώπινα κύτταρα (αντικαρκινικά κύτταρα)

Πότε χορηγούνται αντιβιοτικά?

- Για θεραπεία γνωστών παθογόνων μικροοργανισμών (με γνωστή ευαισθησία)
- Για θεραπεία άγνωστων παθογόνων μικροοργανισμών (εμπειρικά)
- Για πρόληψη των λοιμώξεων

Ποιοι είναι οι παράγοντες που καθορίζουν την επιλογή του κατάλληλου αντιβιοτικού?

Παράγοντες του μικροοργανισμού

- Παθογόνος ή όχι
- Ευαισθησία στα αντιβιοτικά
- Ένας ή περισσότεροι
- Ενδοκυττάριος ή εξωκυττάριος

Παράγοντες του ασθενούς

- Ηλικία
- Εγκυμοσύνη
- Αλλεργίες
- Υποκείμενες νόσοι (ηπατικές νεφρολογικές)
- Ιστορικό λήψης αντιμικροβιακών
- Γενετικοί παράγοντες (έλλειψη G-6-PD)
- Ενδονοσοκομειακός ή εξωνοσοκομειακός

Εντοπισμός της λοίμωξης

- ΚΝΣ
- Ενδοκαρδίτιδα
- Απόστημα
- Παραρρίνιες κοιλότητες
- Οφθαλμός
- Ξένο σώμα

Ποια είναι τα χαρακτηριστικά του
κατάλληλου αντιμικροβιακού
παράγοντα?

- Να εμφανίζει την καλύτερη δραστικότητα έναντι του μικροβίου
- Να είναι ελάχιστα τοξικός
- Να μην καταστρέφει την μικροβιακή φυσιολογική χλωρίδα
- Να έχει τα κατάλληλα φαρμακοκινητικά χαρακτηριστικά
- Να είναι φτηνός

Που δρουν τα αντιβιοτικά?

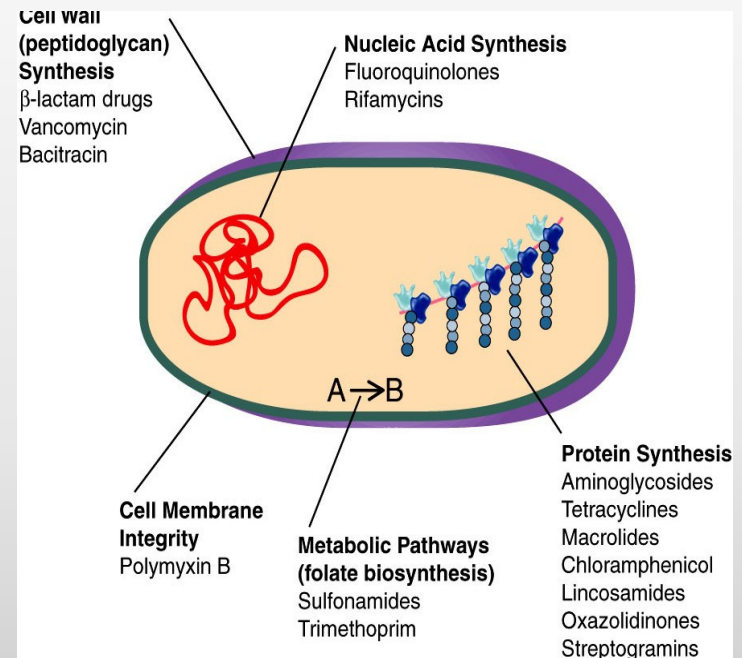
Θέσεις δράσεις των αντιμικροβιακών

- Ταξινομούνται σύμφωνα με:
 - Την χημική τους δομή (β-λακτάμες, αμινογλυκοσίδες)
 - Τον μηχανισμό δράσης(αναστολείς σύνθεσης κυτταρικού τοιχώματος)
 - Την δραστηριότητα εναντίον συγκεκριμένης κατηγορίας μικροοργανισμών (π.χ. βακτήρια, μύκητες ή ιοί)

ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΙ ΔΡΑΣΗΣ ΤΩΝ ΑΝΤΙΒΑΚΤΗΡΙΑΚΩΝ ΦΑΡΜΑΚΩΝ

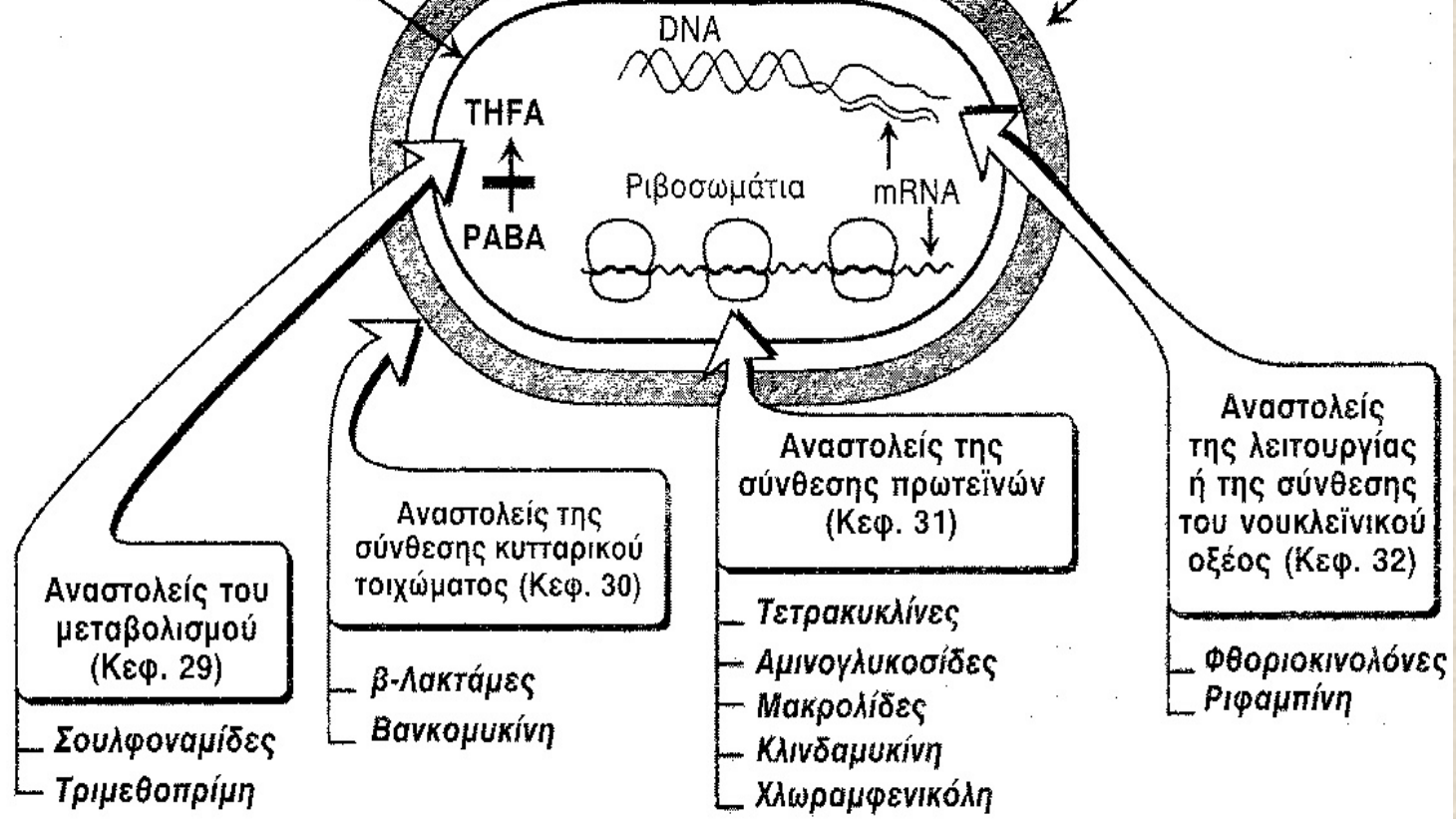
Οι μηχανισμοί δράσης περιλαμβάνουν:

- Αναστολή της σύνθεσης του κυτταρικού τοιχώματος
- Αναστολή της πρωτεϊνοσύνθεσης
- Αναστολή της σύνθεσης του DNA
- Παρεμπόδιση των μεταβολικών οδών
- Επίδραση στην ακεραιότητα της κυτταρικής μεμβράνης.



ΚΥΤΤΑΡΙΚΗ ΜΕΜΒΡΑΝΗ

ΚΥΤΤΑΡΙΚΟ ΤΟΙΧΩΜΑ



Σχήμα 28.9



Ταξινόμηση μερικών αντιμικροβιακών παραγόντων ανάλογα με τη θέση δράσης τους.

ΕΚΛΕΚΤΙΚΗ ΤΟΞΙΚΟΤΗΤΑ



- Ιδιαίτερα αποτελεσματικό ενάντια στο μικρόβιο αλλά χωρίς καμία ή ελάχιστη τοξικότητα στον άνθρωπο
- Ευάλωτοι στόχοι του μικρόβιου για το φάρμακο που δεν υπάρχουν αντίστοιχοι στον άνθρωπο (ευκαρυωτικό)

Παραδείγματα εκλεκτικών στόχων

- Οι β-λακτάμες  Σύνθεση πεπτιδογλυκάνης στο κυτταρόπλασμα. Δεν υπάρχουν στον άνθρωπο.
- Στρεπτομυκίνη, τετρακυκλίνες: Στόχος  πρωτεινοσύνθεση. Διαφορετικά ριβοσώματα στον άνθρωπο (80S) και τα βακτήρια (70S).
- Οι κινολόνες παρεμποδίζουν την DNA αντιγραφή στους προκαρυωτικούς (όχι ευκαρυωτικούς) οργανισμούς.

ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΙ ΔΡΑΣΗΣ

- ***Βακτηριοκτόνα***
Καταστρέφουν άμεσα
τα μικρόβια
- ***Βακτηριοστατικά***
Αναστέλλουν την
ανάπτυξη των
μικροβίων



ΑΝΤΙΜΙΚΡΟΒΙΑΚΟ ΦΑΣΜΑ

- **Ευρέως φάσματος**

Αντιβιοτικά δραστικά έναντι πολλών διαφορετικών Gram (+) και Gram (-) βακτηρίων

- **Περιορισμένου φάσματος**

Δραστικά έναντι λίγων τύπων βακτηρίων

ΣΥΝΕΡΓΕΙΑ ΑΝΤΙΒΙΟΤΙΚΩΝ

- Επίδραση των δύο μεγαλύτερη από την επίδραση του κάθε ενός ξεχωριστά.
- Πχ. πενικιλίνη και στρεπτομυκίνη για τη θεραπεία ενδοκαρδίτιδας. Η ρήξη στο κυτταρικό τοίχωμα που προκαλείται από την πενικιλίνη διευκολύνει την είσοδο της στρεπτομυκίνης στο κύτταρο.



Cooperation Intention

ΕΠΙΔΡΑΣΗ ΣΥΝΔΥΑΣΜΟΥ ΑΝΤΙΒΙΟΤΙΚΩΝ

Σκοποί:

1. Πρόληψη/ ελαχιστοποίηση της εμφάνισης ανθεκτικών στελεχών
2. Μείωση της τοξικότητας κάθε φαρμάκου χωριστά
3. Βελτίωση θεραπευτικού αποτελέσματος

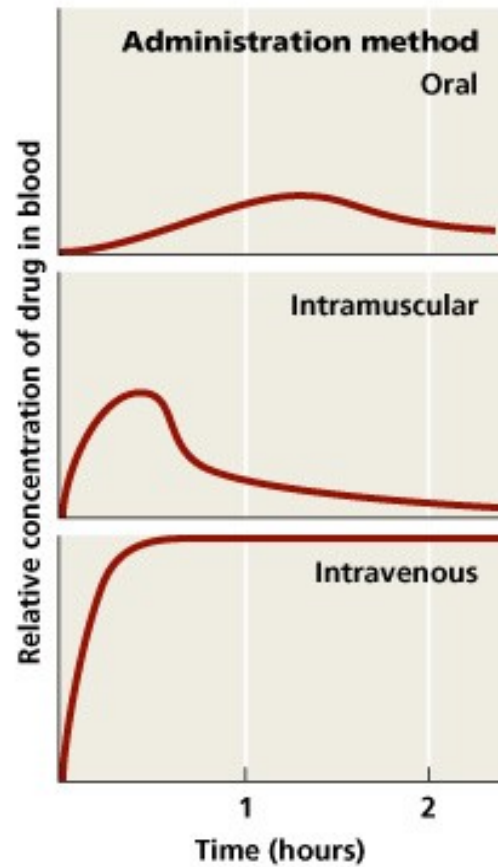
ΑΝΤΑΓΩΝΙΣΤΙΚΗ ΔΡΑΣΗ ΑΝΤΙΒΙΟΤΙΚΩΝ

- Ανταγωνιστικός ο συνδυασμός.
- Π.χ. πενικιλίνη + τετρακυκλίνη: λιγότερο αποτελεσματική θεραπεία. Η βακτηριοστατική δράση της τετρακυκλίνης δεν επιτρέπει τη δράση της πενικιλίνης στη διαίρεση του κυττάρου.

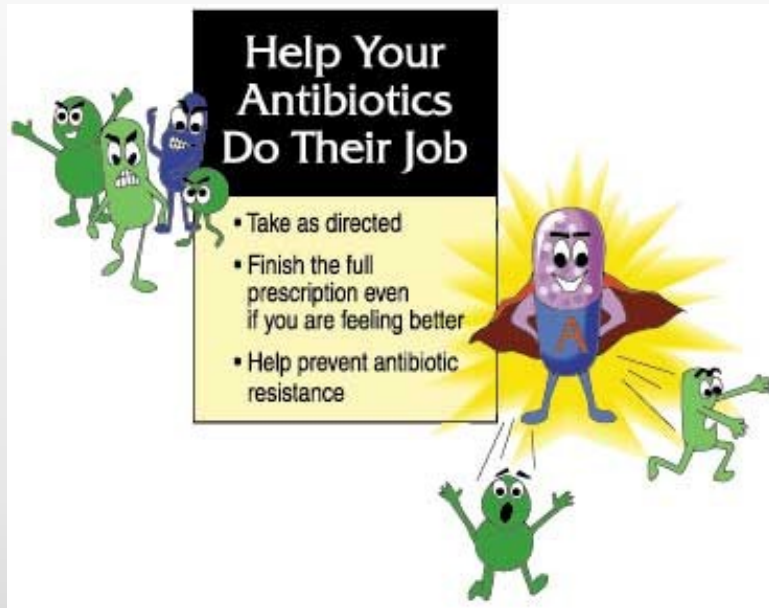


Φαρμακοκινητικές αρχές και όροι

- Βιοδιαθεσιμότητα: το ποσοστό του φαρμάκου που παραμένει δραστικό στη συστηματική κυκλοφορία και εξαρτάται από α) τις φαρμακοκινητικές ιδιότητες του φαρμάκου και β) το μεταβολισμό του μετά την απορρόφηση του
- Απομάκρυνση των αντιμικροβιακών ουσιών από τον οργανισμό:
 - Νεφρά
 - Ήπατοχοληφόρο σύστημα



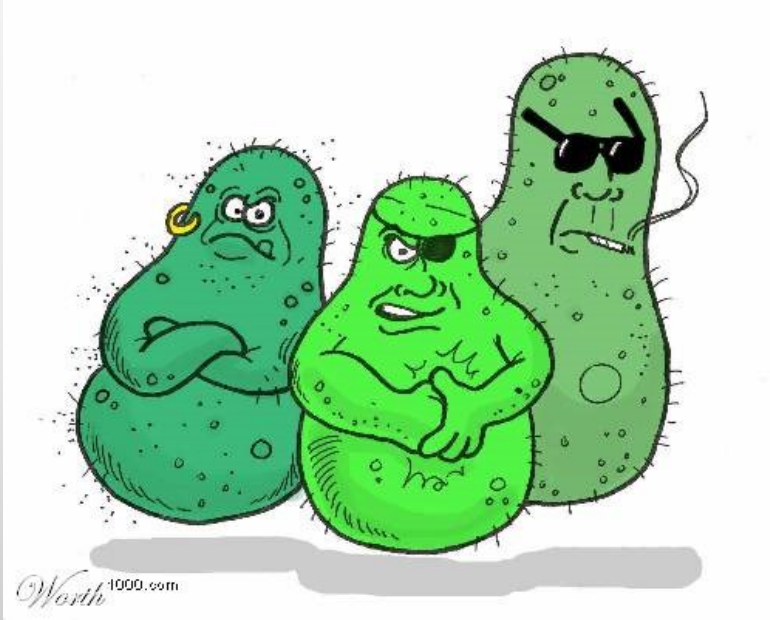
Αντοχή στους αντιμικροβιακούς παράγοντες



- Οι μικροοργανισμοί αναπτύσσουν προοδευτικά μηχανισμούς αντοχής στους αντιμικροβιακούς παράγοντες με αποτέλεσμα να τους καθιστούν μη δραστικούς



Αίτια ανάπτυξης αντοχής



- Φυσική επιλογή
- Αλόγιστη χρήση αντιμικροβιακών ευρέως φάσματος
- Λανθασμένη διάγνωση
- Περιττές συνταγογραφήσεις,
- Ακατάλληλη χρήση από ασθενείς
- Ο εμποτισμός των παιδικών παιχνιδιών με αντιβιοτικά χαμηλής συγκέντρωσης
- Η εκτεταμένη αντιβιοτικών στις εκτροφές ζώων που αποσκοπούν στην αύξηση του βάρους τους.



drugs into humans



drugs into livestock



drugs into soil



drugs into aquatic environment



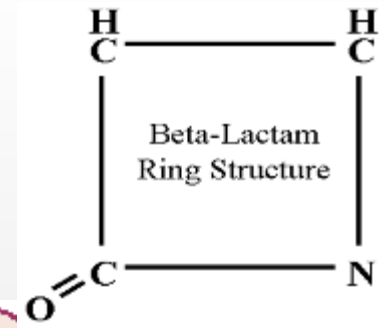
Μηχανισμοί αντοχής στους αντιμικροβιακούς παράγοντες

- Αδρανοποίηση ή τροποποίηση αντιμικροβιακού παράγοντα
- Μετατροπή του βιολογικού στόχου δράσης
- Τροποποίηση της μεταβολικής οδούς
- Παρεμπόδιση στην συνάθροιση του αντιμικροβιακού παράγοντα

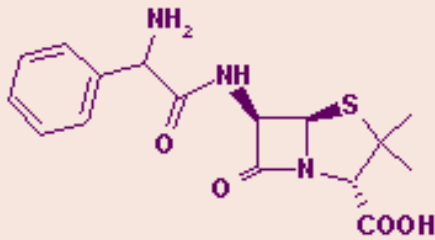
ΟΙ ΚΥΡΙΟΤΕΡΕΣ ΟΜΑΔΕΣ ΤΩΝ ΑΝΤΙΒΙΟΤΙΚΩΝ

1. Β-ΛΑΚΤΑΜΕΣ	6. ΤΕΤΡΑΚΥΚΛΙΝΕΣ
<i>Πενικιλλίνες</i> (πενικιλίνη G, Αμπικιλλίνη αμοξυκιλλίνη τικαρσιλλίνη κλπ.)	7. ΧΛΩΡΑΜΦΕΝΙΚΟΛΗ
Μονομπακτάμες	8. ΠΟΛΥΠΕΠΤΙΔΙΑ
Καρβαπενεμες	9. ΝΙΤΡΟΕΤΕΡΟΚΥΚΛΙΚΑ <i>Νιτροιμιδαζόλες:</i> Μετρονιδαζόλη <i>Νιτροφουράνια:</i> Νιτροφουραντοίνη
Κεφαλοσπορίνες	10. ΣΟΥΛΦΟΝΑΜΙΔΕΣ-ΤΡΙΜΕΘΟΠΡΙΜΗ
Πρώτης γενιάς Δεύτερης γενιάς Τρίτης γενιάς Τέταρτης γενιάς	11. ΚΙΝΟΛΟΝΕΣ (ναλιδιξικό οξύ σιπροφλοξασίνη, οφλοξασίνη κλπ.)
2. ΑΜΙΝΟΓΛΥΚΟΣΙΔΕΣ (στρεπτομυκίνη, νεομυκίνη, γενταμυκίνη κλπ.)	12. ΒΑΝΚΟΜΥΚΙΝΗ
3. ΜΑΚΡΟΛΙΔΕΣ (ερυθρομυκίνη, κλαριθρομυκίνη αζιθρομυκίνη κλπ.)	13. ΦΟΥΣΙΔΙΚΟ ΟΞΥ
4. ΛΙΝΚΟΖΑΜΙΝΕΣ (κλινδαμυκίνη, λινκομυκίνη)	14. ΤΕΙΚΟΠΛΑΝΙΝΗ
5. ΣΠΕΚΤΙΝΟΜΥΚΙΝΗ	15. ΑΝΤΙΦΥΜΑΤΙΚΑ ΦΑΡΜΑΚΑ (ριφαμπικίνη, ισονιαζίδη, κυκλοσερίνη κλπ.)

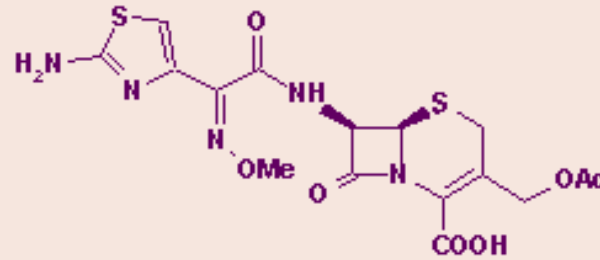
※ B-LAKTAMIKA ANTIBIOTIKA



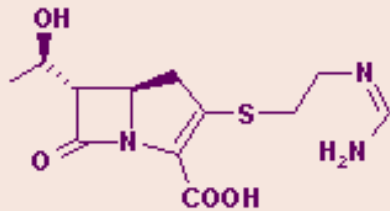
Semisynthetic β -lactam antibiotics with natural skeleton



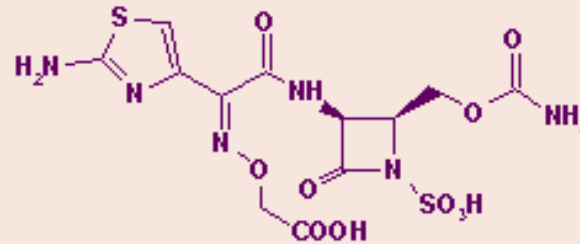
Penicillins (ampicillin)



Cefalosporins (cefotaxime)



Carbapenems (imipenem)



Monobactams (carumonam)

B-ΛΑΚΤΑΜΙΚΑ ΑΝΤΙΒΙΟΤΙΚΑ

Χαρακτηρίζονται από την παρουσία του β -λακταμικού δακτυλίου στο μόριό τους. Τέτοια είναι οι:

- **Πενικιλίνες**
- **Κεφαλοσπορίνες (1^{ης} 2^{ης} 3^{ης} 4^{ης} γενιάς)**
- **Μονομπακτάμες (Αζτρεονάμη)**
- **Καρβαπενέμες (Ιμιπενέμη +σιλαστίνη Primaxin)**

Β-ΛΑΚΤΑΜΙΚΑ ΑΝΤΙΒΙΟΤΙΚΑ

(Τετραμελής β-λακταμικός δακτύλιος)

- -Φάσμα δράσης Gram (+) Gram (-)

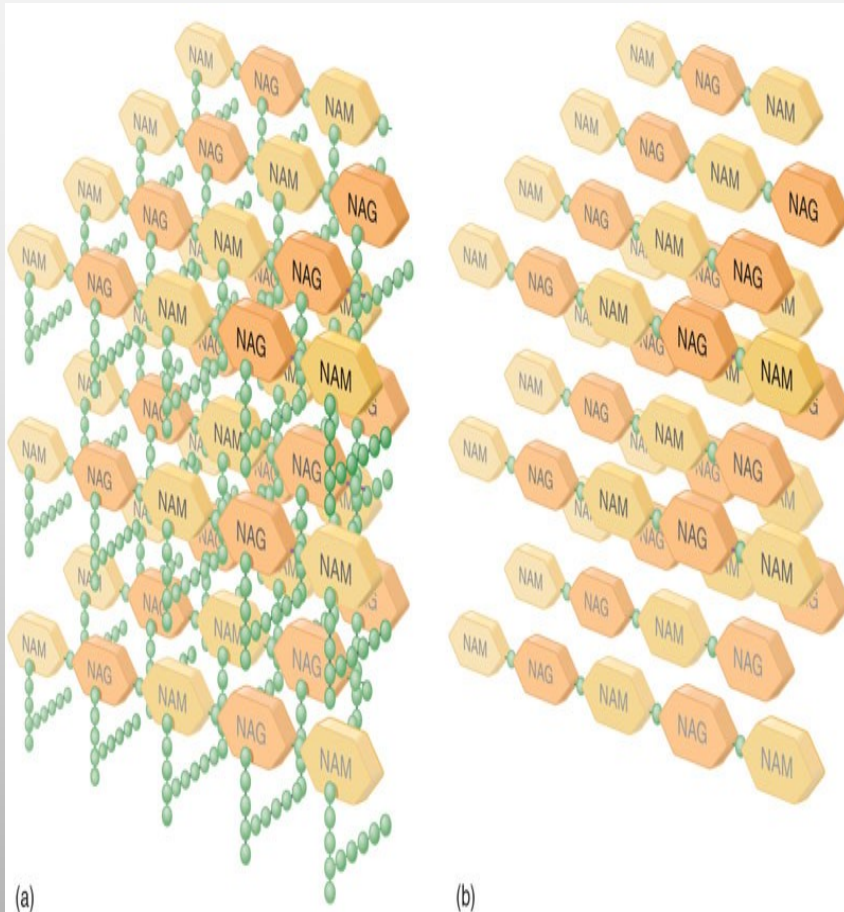
Μικροβιοκτόνα

Μηχανισμός δράσης:

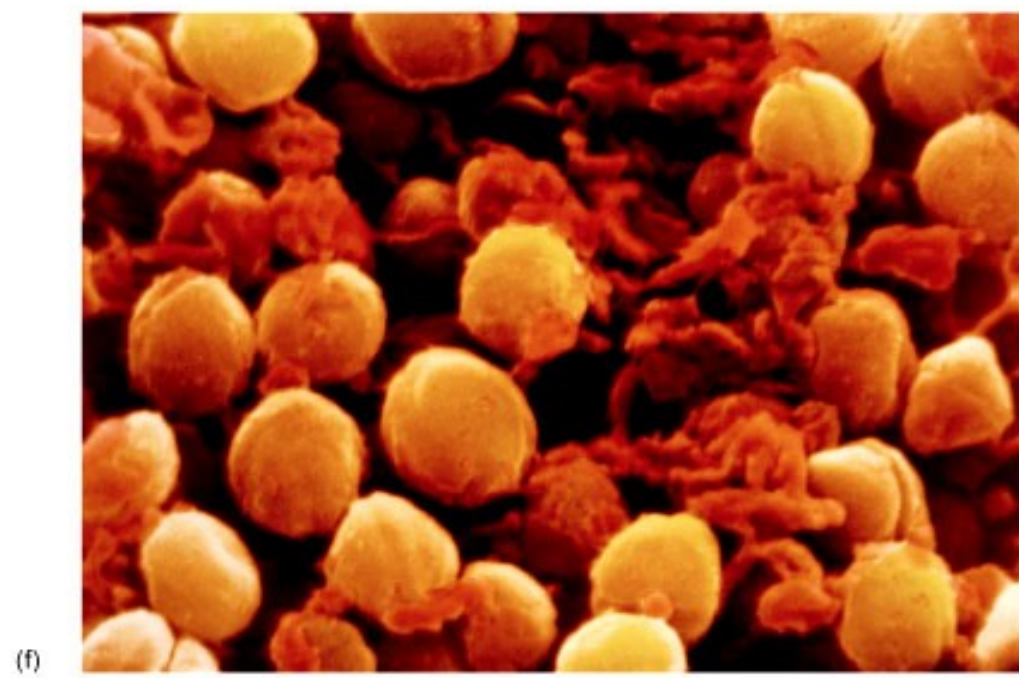
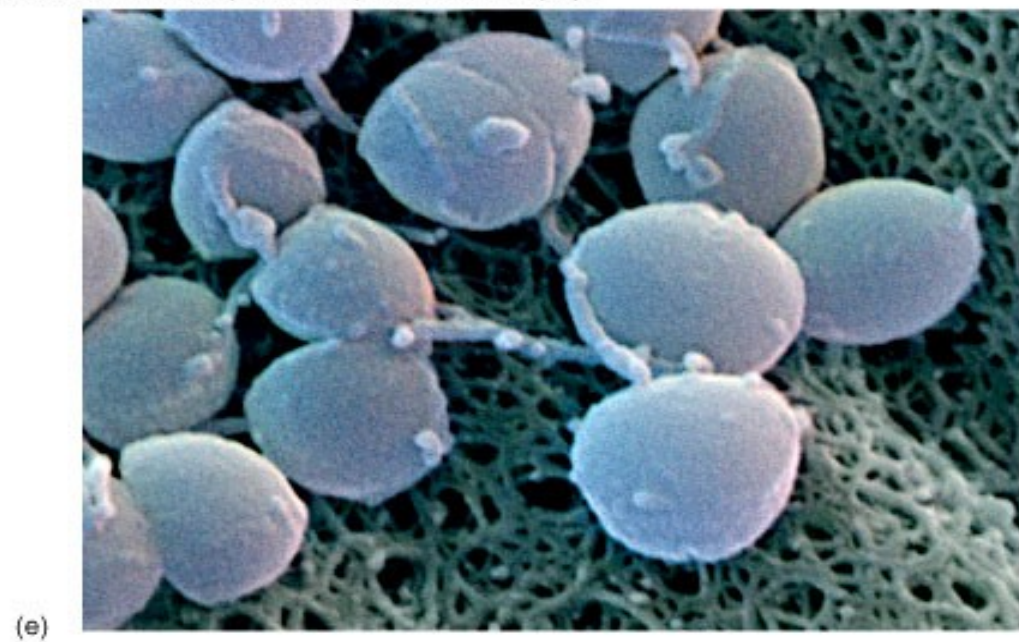
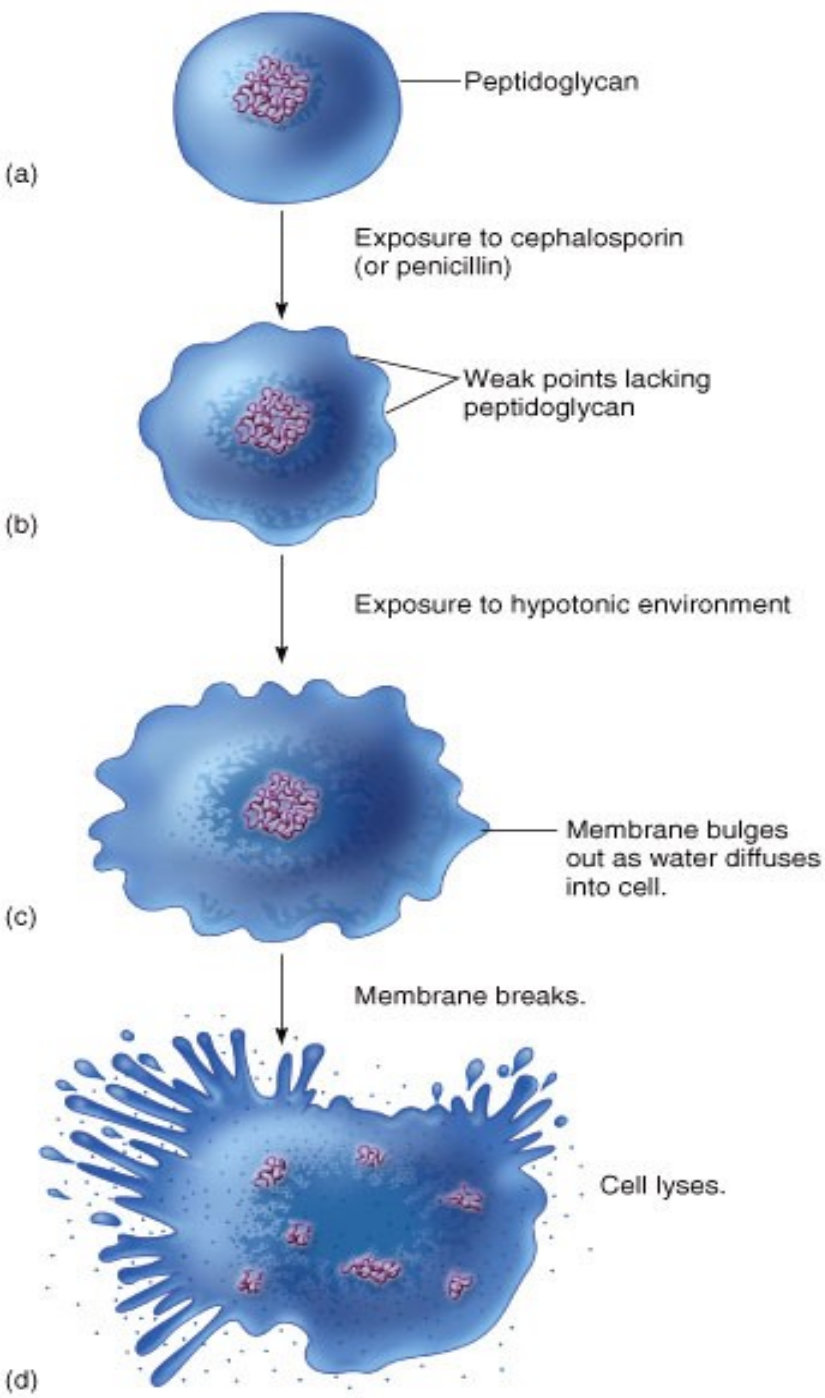
Σύνθεση κυτταρικού τοιχώματος

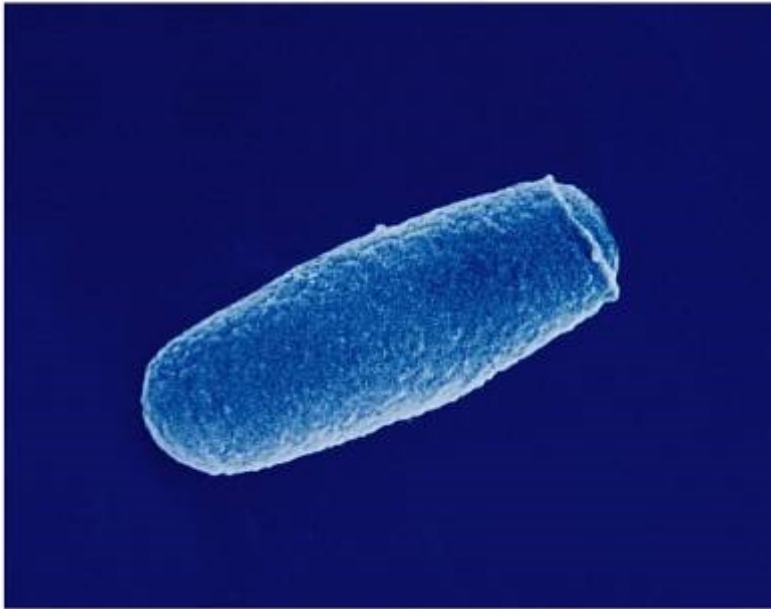
- Συνδέονται με τις δεσμευτικές πρωτεΐνες της κυτταροπλασματικής μεμβράνης (PBPs)
- Παρεμποδίζουν τη σύνθεση της πεπτιδογλυκάνης του κυτταροπλάσματος
- Δρουν στη φάση του κυτταρικού πολλαπλασιασμού

ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΣ ΔΡΑΣΗΣ Β- ΛΑΚΤΑΜΩΝ



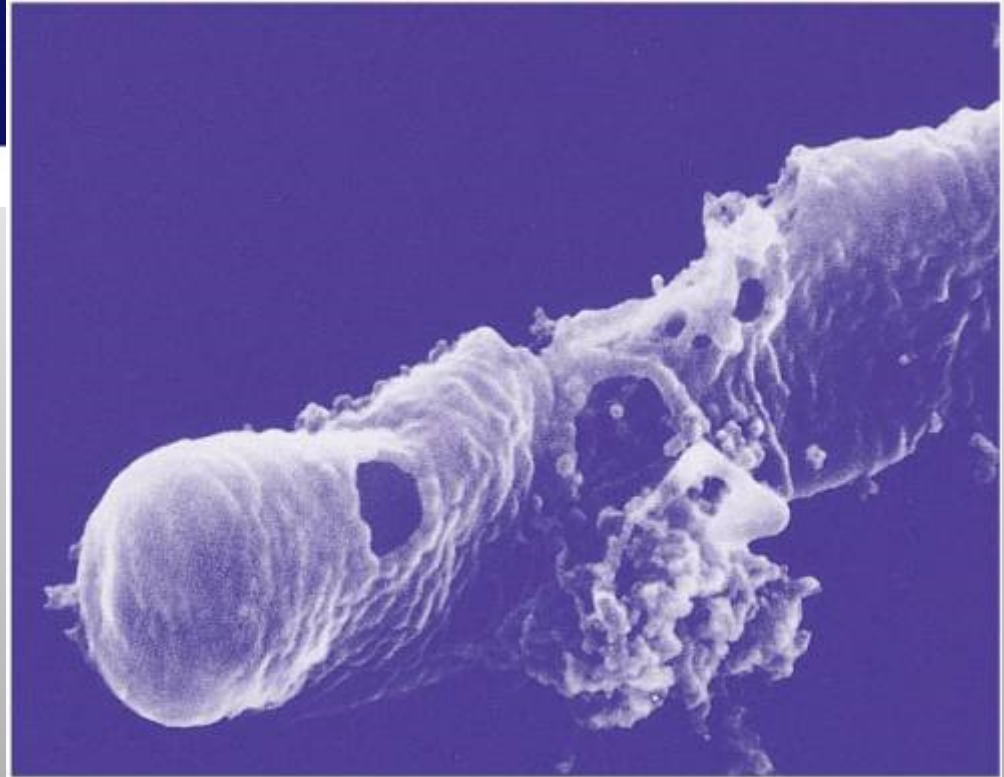
- Ανταγωνιστικά εμποδίζουν τη λειτουργία των πενικιλλινοδεσμευτικών πρωτεϊνών
- Εμποδίζουν το σχηματισμό πεπτιδικών δεσμών μεταξύ των μορίων γλυκάνης
- Το κυτταρικό τοίχωμα αναπτύσσει αδύνατα σημεία και γίνεται εύθραυστο.





(b)

Copyright © 2004 Thomson Education, Inc., publishing as Benjamin Cummings.



(e)

ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΙ ΑΝΤΟΧΗΣ ΣΤΙΣ Β-ΛΑΚΤΑΜΕΣ

- Παραγωγή β-λακταμασών (πενικιλινασών)
- Απώλεια της συγγένειας με τις πενικιλλοδεσμευτικές πρωτεΐνες
- Ελάττωση της διαπερατότητας του κυτταρικού τοιχώματος

ΠΕΝΙΚΙΛΛΙΝΕΣ

Φυσικές (Μύκητας *Penicillium*)

Πενικιλλίνες G, V

- Στενού μικροβιακού φάσματος (Gram +)
- Καταστρέφονται από τις πενικιλλινάσες

Ημισυνθετικές

- Σκοπός: Ευρύ φάσμα (Gram +/-) (*αμπικιλλίνη, αμοξικιλίνη κλπ.*) ή
- Αντοχή στις πενικιλλινάσες (*οξακιλλίνη, φλουκοξακιλλίνη, μεθικιλίνη*)

ΑΝΑΣΤΟΛΕΙΣ ΤΩΝ Β-ΛΑΚΤΑΜΑΣΩΝ

- Αμπικιλλίνη + σουλμπακτάμη (Begalín)
- Αμοξυκιλλίνη + κλαβουλανικό (Augmentín)
- Τικαρσιλλίνη + κλαβουλανικό (Timentín)
- Πιπερακιλλίνη + ταζομπακτάμη (Tazocín)

ΚΕΦΑΛΟΣΠΟΡΙΝΕΣ

Κατατάσσονται σε 4 γενεές που διαφέρουν μεταξύ τους:

- Στο αντιμικροβιακό φάσμα-Δραστικές στα Gram (-)
- Στη σταθερότητα τους έναντι των β- λακταμασών
- Στη φαρμακοκινητική
- Ανθεκτικές στις πενικιλλινάσες

ΜΑΚΡΟΛΙΔΕΣ

- Μικροβιοκτόνα
- Φάσμα δράσης ευρύ κυρίως Gram (+) αλλά και Gram (-)
- Κυριότερος εκπρόσωπος η ερυθρομυκίνη

Μηχανισμοί δράσης

Αναστολή πρωτεϊνοσύνθεσης συνδεόμενες με την υποομάδα 50S των ριβοσωμάτων

ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΙ ΑΝΤΟΧΗΣ ΣΤΙΣ ΜΑΚΡΟΛΙΔΕΣ

Μηχανισμός αντοχής μέσω γονιδίων στα
χρωμοσώματα ή πλασμιδίων

- Ελάττωση της διαπερατότητας του κυτταρικού τοιχώματος
- Αλλαγές στη δομή των ριβοσωμάτων
- Ενζυμική αδρανοποίηση

ΑΜΙΝΟΓΛΥΚΟΣΙΔΕΣ

Μικροβιοκτόνα

-Φάσμα δράσης Gram (+) Gram (-)

- Δράση: Δρουν στη φάση της πρωτεΐνοσύνθεσης
- Σύνδεση με 30s ριβοσωμιακή υπομονάδα
- Λανθασμένη ανάγνωση του m-RNA
- Παραγωγή παθολογικών πρωτεϊνών



Καταστολή του πολλαπλασιασμού του κυττάρου

ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΙ ΑΝΤΟΧΗΣ ΣΤΙΣ ΑΜΙΝΟΓΛΥΚΟΣΙΔΕΣ

- Εμφάνιση μεταλλάξεων στο ριβοσωμάτιο όπου ανήκει η υπομονάδα 30S
- Ενζυμική αδρανοποίηση. Τα ένζυμα παράγονται από πλασμίδια → τροποποιούν το μόριο των αμινογλυκοσιδών. Δρουν ενδοκυττάρια

ΤΕΤΡΑΚΥΚΛΙΝΕΣ

- Ευρύ φάσμα δράσης:
- Gram (-) και Gram (+) αερόβια και αναερόβια και επιπλέον
 - Ρικέτσιες
 - Χλαμύδια
 - Σπειροχαίτες
 - Μυκοπλάσματα

ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΣ ΔΡΑΣΗΣ ΤΕΤΡΑΚΥΚΛΙΝΩΝ

- Μικροβιοστατικά (σε μεγάλες δόσεις μικροβιοκτόνα)

Μηχανισμός δράσης

Δράση στην 30s ριβοσωμιακή υπομονάδα



Παρεμποδίζουν την προσκόλληση του t-RNA στο mRNA



αναστολή πρωτεϊνοσύνθεσης

ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΙ ΑΝΤΟΧΗΣ ΣΤΙΣ ΤΕΤΡΑΚΥΚΛΙΝΕΣ

Αναστολή της μεταφοράς του αντιμικροβιακού παράγοντα στο βακτηριδιακό κύτταρο.

Προκαλείται από:

- Πλασμίδια (πλασμιδιομεταφερόμενη αντοχή)
- Χρωμοσωμιακές αλλοιώσεις

ΚΙΝΟΛΟΝΕΣ (νεώτερες)

- Μικροβιοκτόνα
- Φάσμα δράσης ευρύ Gram (+) Gram (-) αερόβια
- Άριστη φαρμακοκινητική και ιδιαίτερα στο γαστρεντερικό σύστημα

ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΣ ΔΡΑΣΗΣ ΤΩΝ ΚΙΝΟΛΟΝΩΝ

- Δρουν αναστέλλοντας τη γυράση του DNA (αναστολή της αναδίπλωσης)

Μηχανισμοί αντοχής

- Δεν αναφέρεται συχνά πλασμιδιομεταφερόμενη αντοχή
- Μετατροπές στους βιολογικούς στόχους δράσης των κινολονών (γονιδιακές μεταλλάξεις της γυράσης)
- Ελαττωμένη κυτταρική διαπερατότητα

ΣΟΥΛΦΟΝΑΜΙΔΕΣ

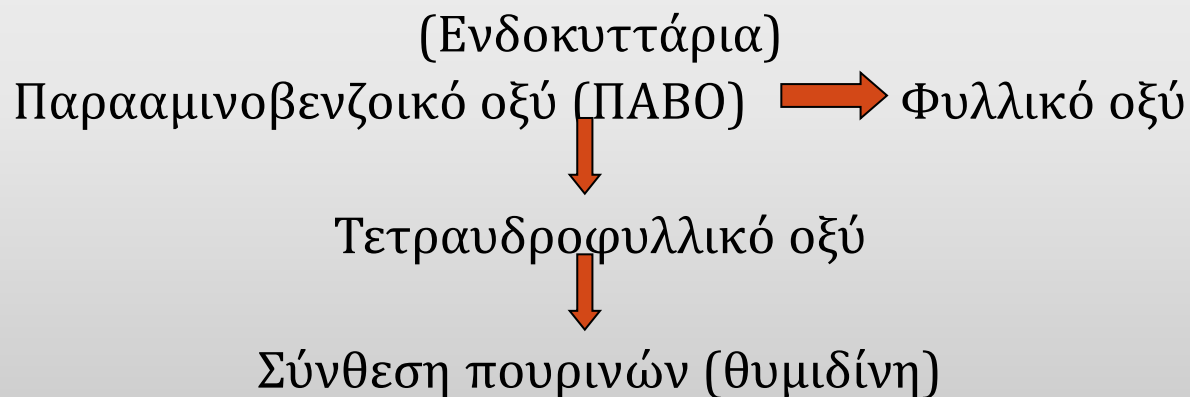
Μικροβιοκτόνα

Φάσμα δράσης: Gram (+) και Gram (-) αερόβια
Σπάνια χρησιμοποιούνται ως μονοδραστικές
ουσίες, συχνά σε συνδυασμό με τριμεθοπρίμη

ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΣ ΔΡΑΣΗΣ ΣΟΥΛΦΟΝΑΜΙΔΩΝ

Αναστολή της σύνθεσης του DNA

Τα βακτηριακά κύτταρα δεν έχουν την ικανότητα να προσλαμβάνουν φυλλικό οξύ από το περιβάλλον αλλά το παράγουν



Οι σουλφοναμίδες έχουν παρόμοια δομή με το ΠΑΒΟ και δρουν ανταγωνιστικά

ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΣ ΑΝΤΟΧΗΣ ΣΤΙΣ ΣΟΥΛΦΟΝΑΜΙΔΕΣ

- Χρωματοσωματικές μεταλλάξεις
- Πλασμίδια

Επιτυγχάνονται τα παρακάτω:

- Μειωμένη κυτταρική διαπερατότητα στις σουλφοναμίδες
- Παραγωγή μιας συνθετάσης του φυλλικού οξέος με μικρότερη συγγένεια στις σουλφοναμίδες παρά προς το ΠΑΒΟ

ΚΛΙΝΔΑΜΥΚΙΝΗ

- Μικροβιοστατικό και μικροβιοκτόνο φάσμα δράσης Gram (+) αερόβια και αναερόβια
- Δρα αναστέλλοντας τη βιοσύνθεση των πρωτεϊνών (παρεμβολή στη μεταφορά των πεπτιδίων κατά τη διαδικασία επιμήκυνσης της πεπτιδικής αλυσίδας)

Μηχανισμός αντοχής

- Μέσω γονιδίων στα χρωμοσώματα ή πλασμιδίων ελάττωσης της διαπερατότητας του κυτταρικού τοιχώματος
- Αλλαγές στη δομή των ριβοσωμάτων
- Ενζυμική αδρανοποίηση

BANKOMYKINΗ

Μικροβιοκτόνο

Φάσμα δράσης Gram (+) αερόβια

Μηχανισμός δράσης

- Δρα στη φάση του κυτταρικού πολλαπλασιασμού. Εκλεκτικός αναστολέας της σύνθεσης του κυτταρικού τοιχώματος, παρεμποδίζοντας τον πολυμερισμό της πεπτιδογλυκάνης
- Αναστέλλει τη σύνθεση του RNA και
- Μεταβάλλει τη διαπερατότητα της κυτταρικής μεμβράνης
- Μηχανισμός ανάπτυξης αντοχής είναι πλασμιδιακός

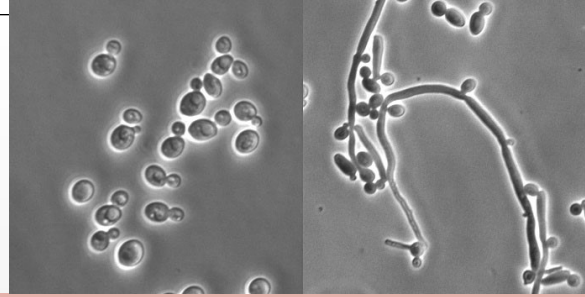
ΧΛΩΡΑΜΦΕΝΙΚΟΛΗ

Ευρύ φάσμα δράσης_Gram (+) και Gram (-) σπειροχαίτες
χλαμύδια, ρικέτσιες και μυκοπλάσματα.

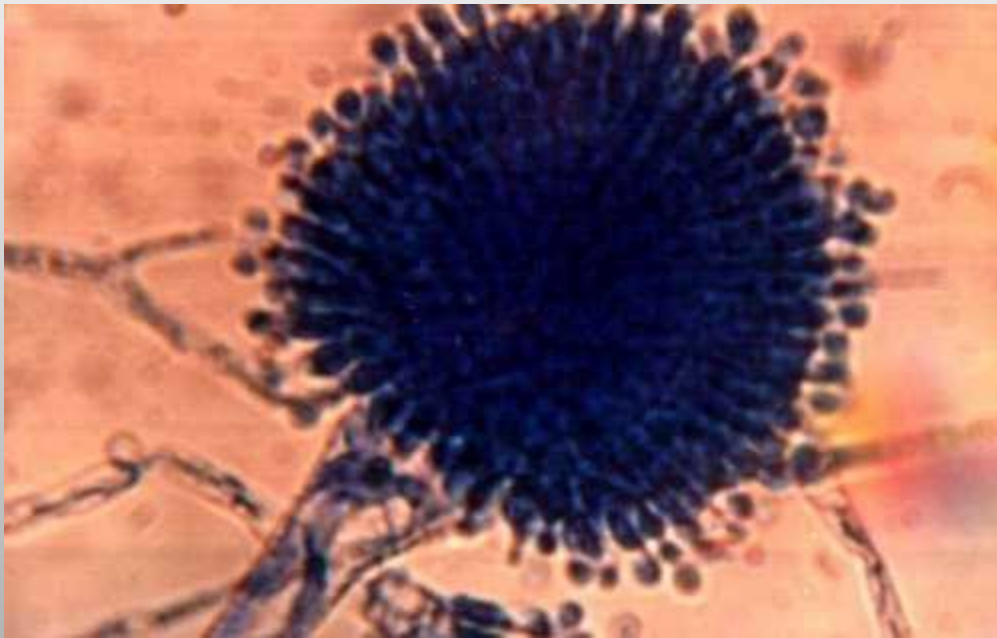
Συχνά τοξικό για τον άνθρωπο (απλασία μυελού)

Μηχανισμοί δράσης

- Αναστολή πρωτεΐνοσύνθεσης
- Ενώνεται με υποομάδα 50S των μικροβιακών ριβοσωμάτων και αναστέλλει το σχηματισμό των πεπτιδικών δεσμών
- Αναστέλλει την ένωση του mRNA με το ριβόσωμα



ΑΝΤΙΜΥΚΗΤΙΑΣΙΚΑ ΦΑΡΜΑΚΑ

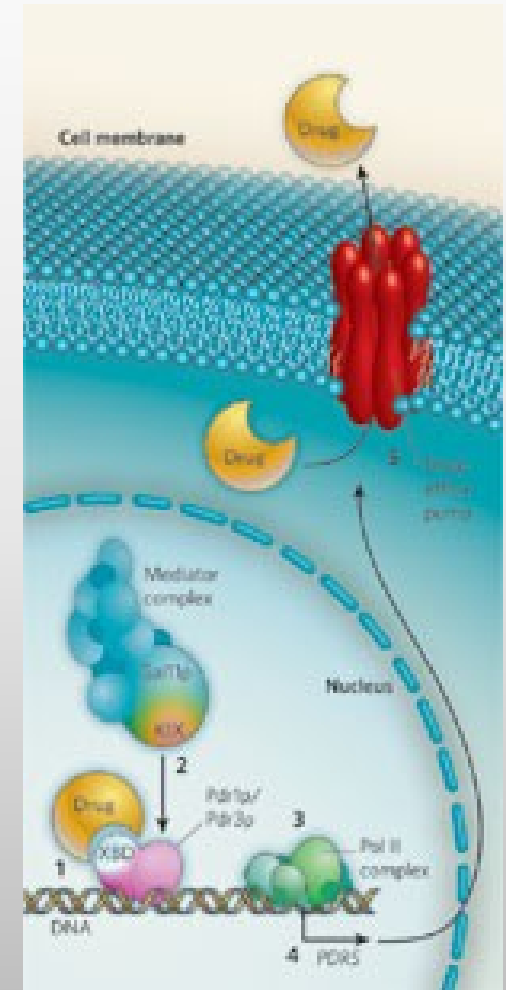


ΣΤΟΧΟΣ ΔΡΑΣΗΣ

- Ευκαρυωτικοί οργανισμοί: Δύσκολη η εκλεκτική τοξικότητα
- Αυξανόμενη συχνότητα μυκητιασικών λοιμώξεων σε ανοσοεπαρκείς

Στόχοι:

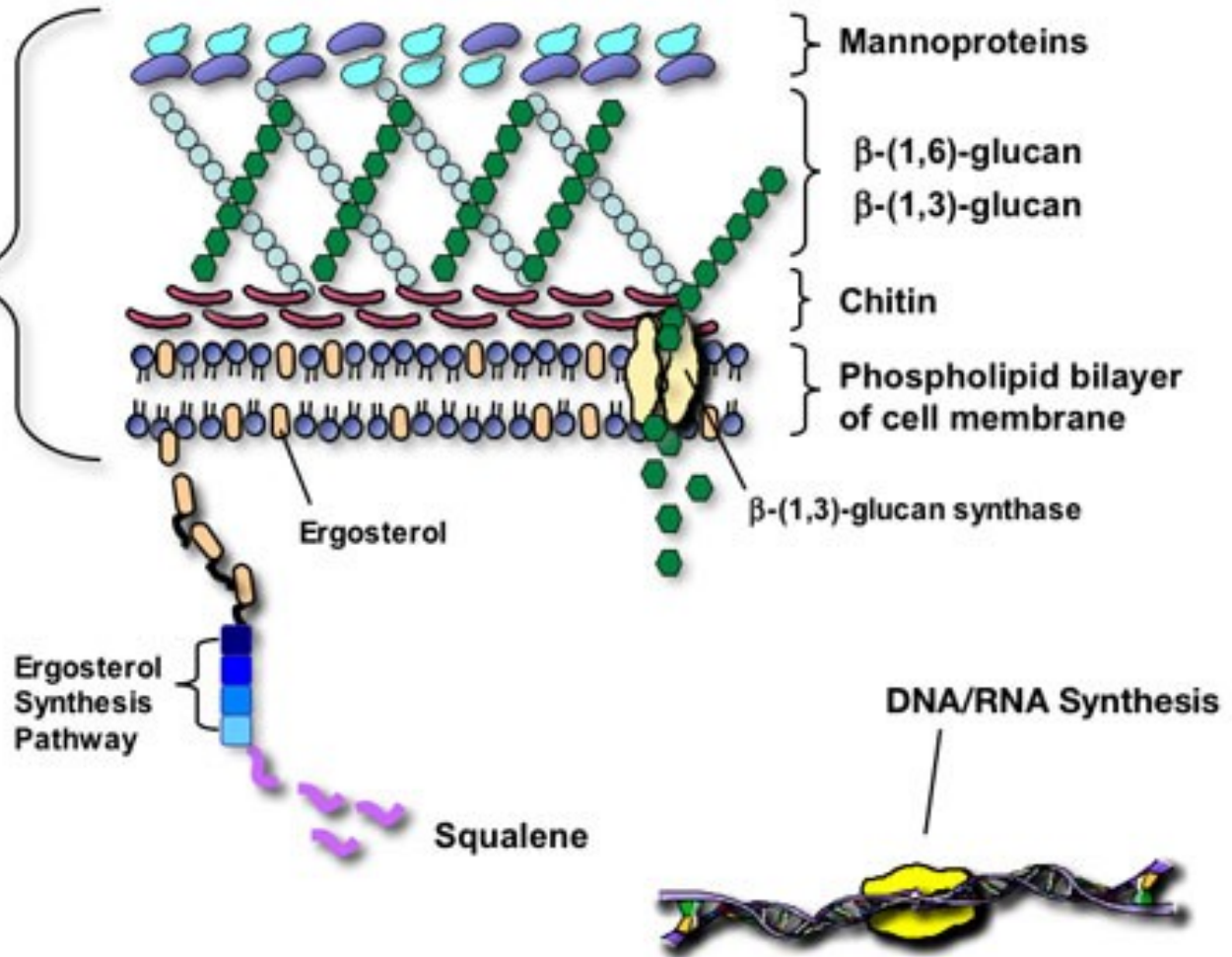
- Διακοπή βιοσύνθεσης στερολών της κυτταρικής μεμβράνης όπως η εργοστερόλη
- Διακοπή βιοσύνθεσης της β-γλυκάνης (εχινοκαντίνες)
- Αναστολή σύνθεσης νουκλειικών οξέων



Fungal cell



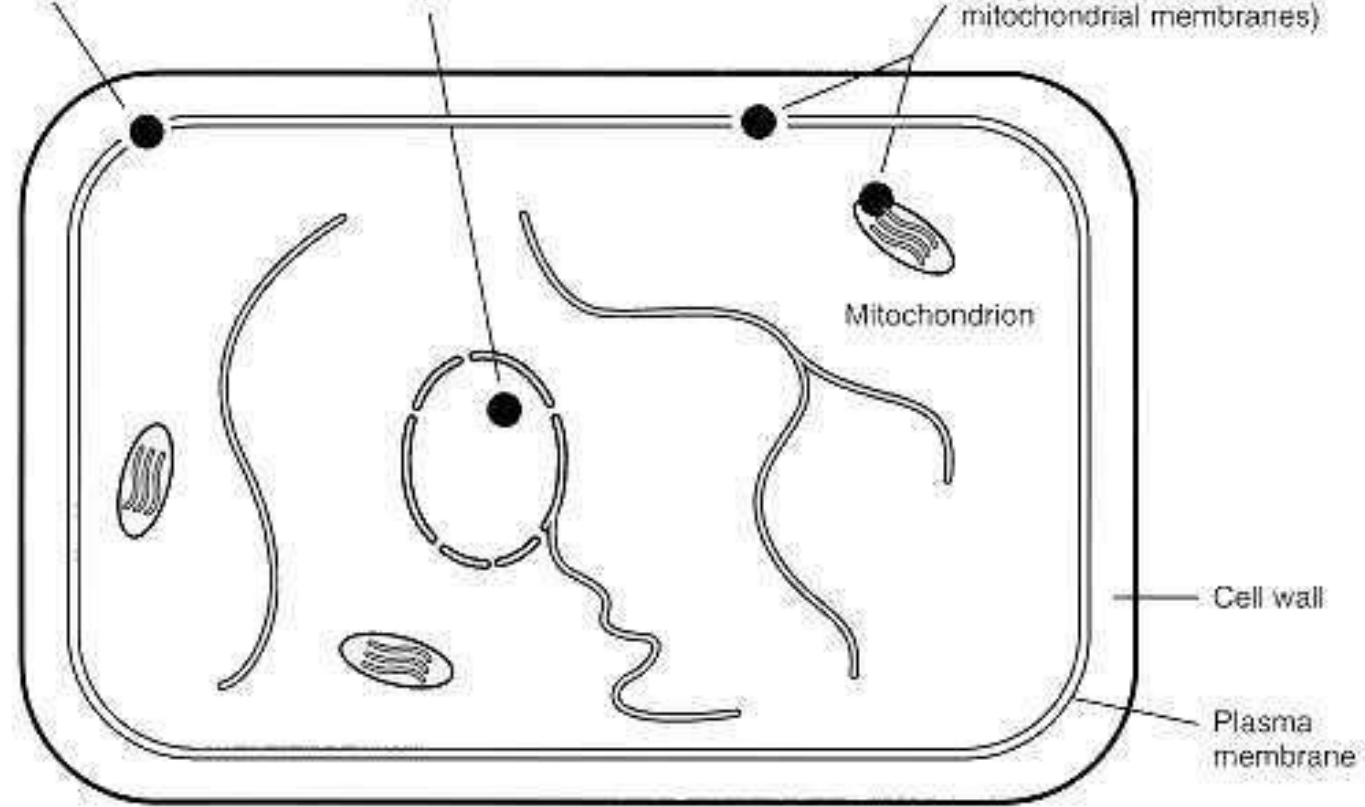
Cell membrane and cell wall



Polyenes
Integration into cell membrane

5-Fluorocytosine
Interruption of DNA & RNA synthesis

Azoles
Interruption of sterol biosynthesis (cell and mitochondrial membranes)



ΚΑΤΗΓΟΡΙΕΣ ΑΝΤΙΜΥΚΗΤΙΑΣΙΚΩΝ

Στόχος-κυτταρική μεμβράνη

- Πολυένια

Αμφοτερικίνη Β-φάρμακο εκλογής για συστηματικές λοιμώξεις-Μεγάλη τοξικότητα

- Αζόλες

- Μικοναζόλη, κλοτριμαζόλη

Ευρεία χρήση (τοπικές δερματικές λοιμώξεις, κολπίτιδα κλπ.)

- Κετοконаζόλη: συστηματικές λοιμώξεις-μικρότερη τοξικότητα

- Αλλυλαμίνες

Κατηγορίες αντιμυκητιασικών

Στόχος- κυτταρικό τοίχωμα

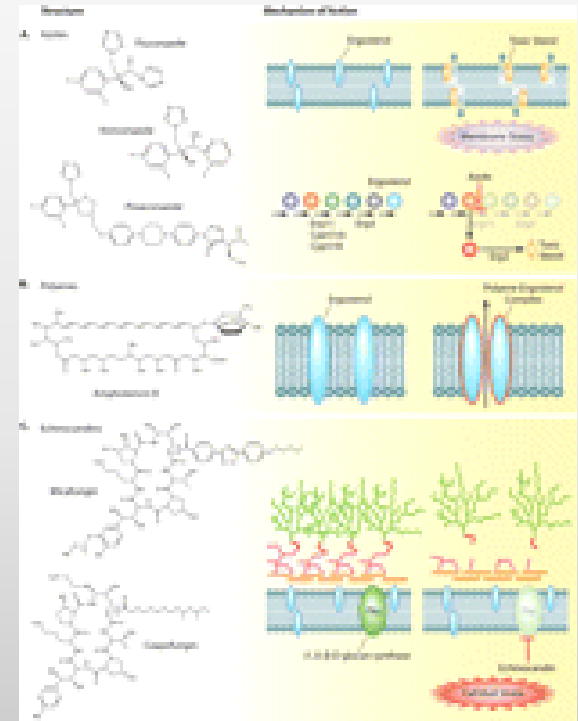
- *Εχινοκαντίνες*

Αναστολείς σύνθεσης DNA

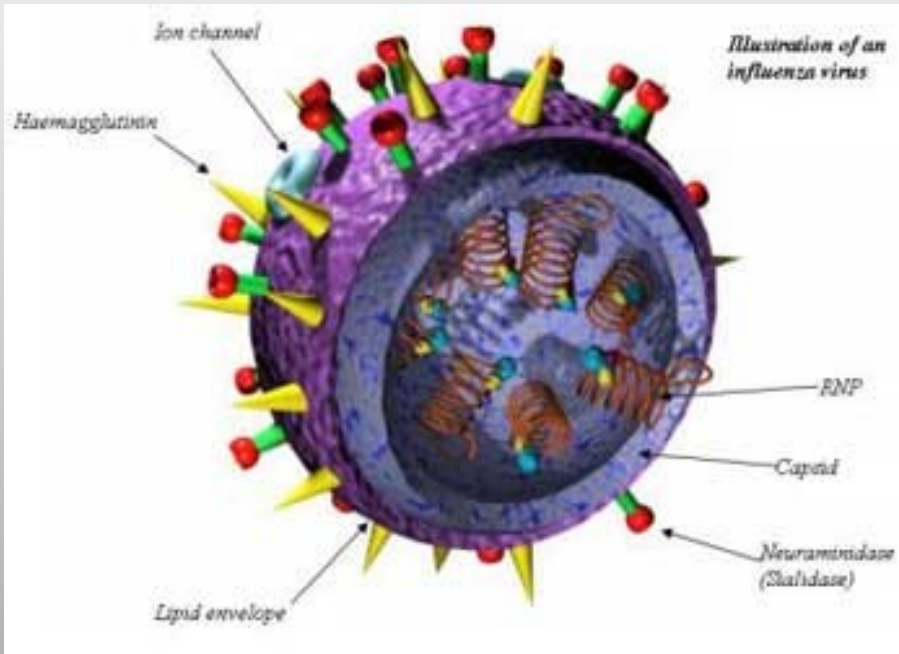
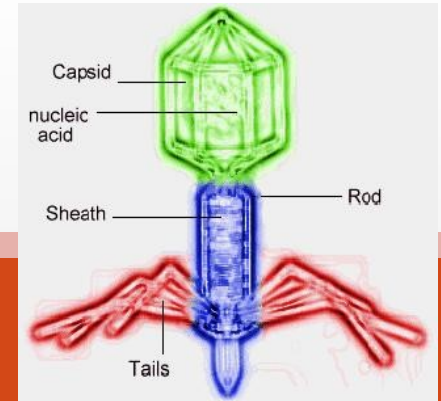
- *Φθοριοκυτοσίνη*

Άλλα

- *Γκριζεοφουλβίνη*
- *Τολναφτάτη κλπ.*



ΑΝΤΙΪΚΑ ΦΑΡΜΑΚΑ

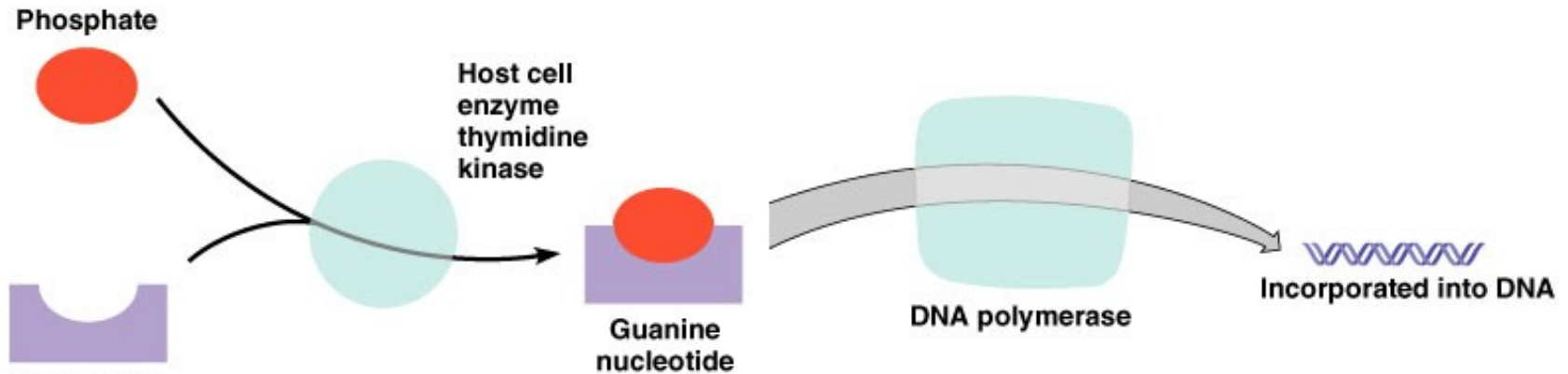


ΜΗΧΑΝΙΣΜΟΙ ΔΡΑΣΗΣ

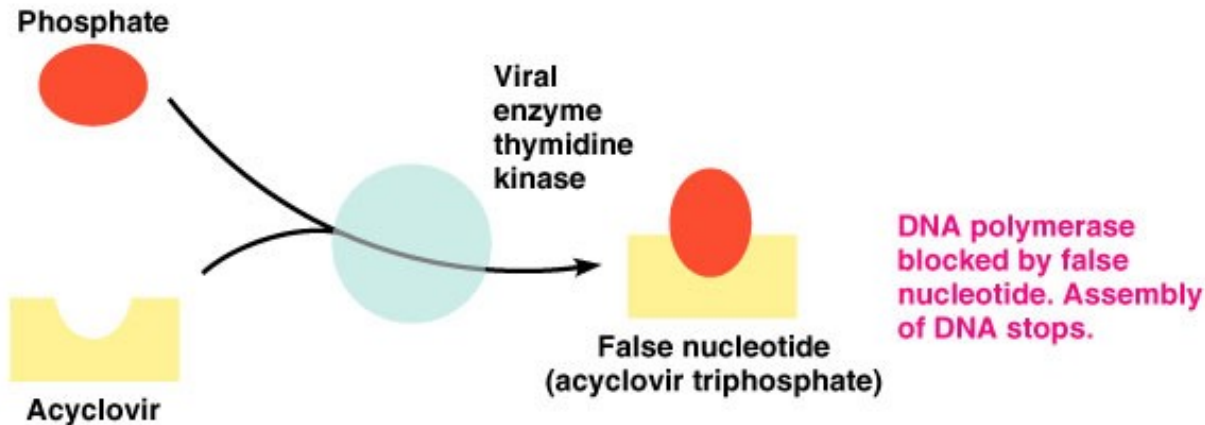


- Παρεμπόδιση εισόδου του ιού στο κύτταρο
- Παρεμπόδιση εξόδου του ιού από το κύτταρο
- Στοχοθέτηση της αντιγραφής ιικού RNA/DNA:
Νουκλεοσιδικά και νουκλεοτιδικά ανάλογα δομικών συστατικών του ιικού DNA και RNA
- Αναστολή άλλων ιικών ενζύμων ώστε να μην μπορούν να συντεθούν ικές πρωτεΐνες
 - Πρωτεάσης (αταζαναβίρη, ιντιναβίρη σακιναβίρη)
 - Ιντεγκράσης
 - Νευραμινιδάσης (TAMIFLU)
- Αναστολή σύντηξης του ιικού φακέλου με την κυτταρική μεμβράνη

ΑΝΑΛΟΓΑ DNA ΣΥΝΘΕΣΗΣ



(b) Synthesis of normal viral DNA guanine nucleotide

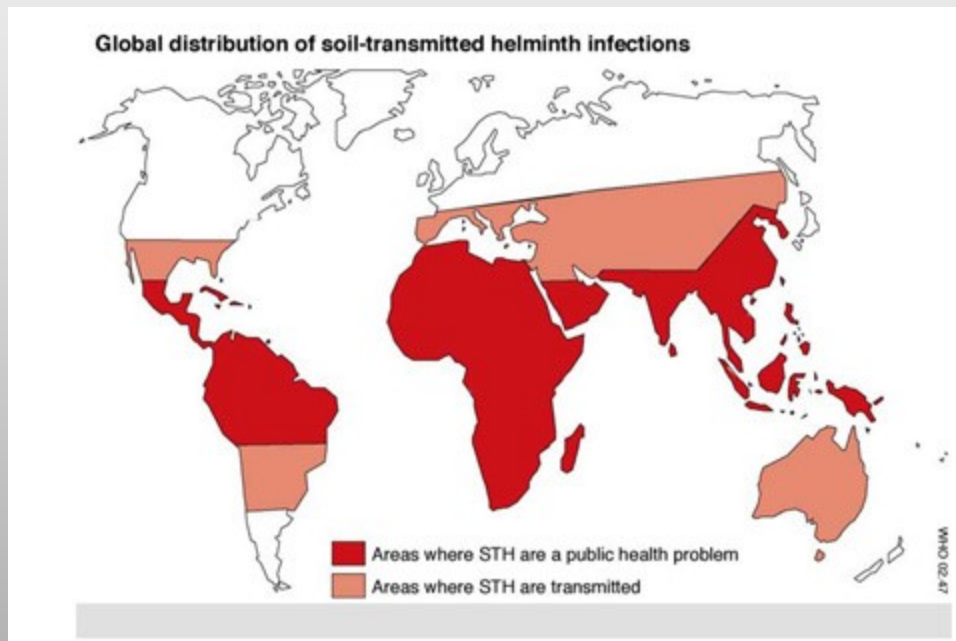


(c) Synthesis of false viral DNA nucleotide with acyclovir

ΙΝΤΕΡΦΕΡΟΝΕΣ

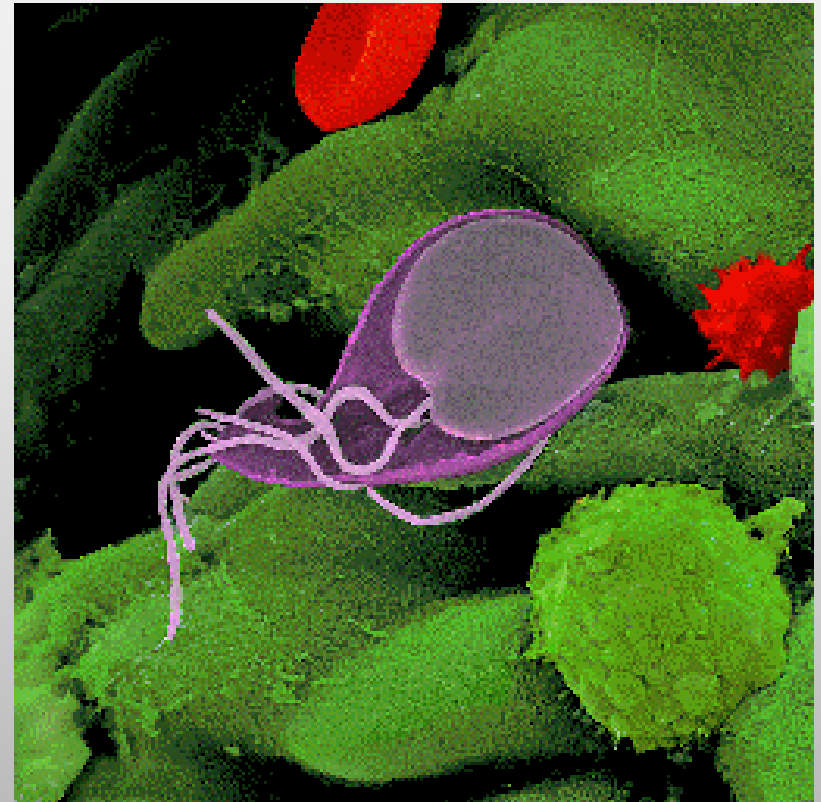
- Παράγονται από μολυσμένα κύτταρα
- Αναστέλλουν την περαιτέρω μόλυνση
- Ιντερφερόνη α: Θεραπεία εκλογής για ηπατίτιδες
- Imiquimod: Επάγει την παραγωγή ιντερφερονων

ΑΝΤΙΠΡΩΤΟΖΩΙΚΑ ΚΑΙ ΑΝΘΕΛΜΙΝΘΙΚΑ ΦΑΡΜΑΚΑ



ΑΝΤΙΠΡΩΤΟΖΩΙΚΑ ΦΑΡΜΑΚΑ

- Τα πρωτόζωα είναι ευκαρυωτικοί οργανισμοί
- Πολλά φάρμακα είναι πειραματικά και ο τρόπος δράσης τους είναι άγνωστος



ΑΝΤΙΠΡΩΤΟΖΩΙΚΑ ΦΑΡΜΑΚΑ

- Κινίνη, χλωροκίνη → ελονοσία
- Κινακρίνη → γιαρδίαση
- ΜΕΤΡΟΝΙΔΑΖΟΛΗ (FLAGYL) Το πιο διαδεδομένο
Δράση: αναστολή αναεροβίων μεταβολικών μηχανισμών

ΑΝΘΕΛΜΙΝΘΙΚΑ ΦΑΡΜΑΚΑ

Μηχανισμοί δράσης:

- Αναστολή παραγωγής ΑΤΡ στα μιτοχόνδρια (Νικλοσαμίδα)
- Μεταβολή διαπερατότητας μεμβράνης των κυττάρων (πραζικουαντέλη)
- Αναστολή απορρόφησης θρεπτικών ουσιών (Μεβενδαζόλη, αλβενδαζόλη)
- Παράλυση έλμινθα (ιβερμεκτίνη)