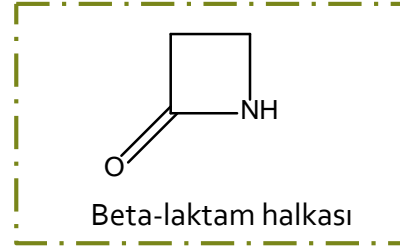


BETA-LAKTAM ANTİBİYOTİKLER

-FARMAKOLOJİ

-ANTİBİYOTİKLER

-BETA-LAKTAM ANTİBİYOTİKLER



BETA-LAKTAM ANTİBİYOTİKLER

PENİSİLİNLER

SEFALOSPORİNLER

KARBAPENEMLER

MONOBAKTAMLAR

BETA-LAKTAMAZ
İNİBİTÖRLERİ

PENİSİLİNLER

Penisilinler

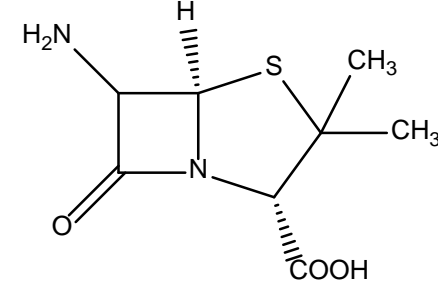
- **İlk** bulunan antibiyotiktir. Yeni türevlerinin de bulunmasıyla en hızlı gelişim gösteren antibiyotik grubudur.
- **Güçlü bakterisid** etkili, alerjik olmayanlarda **düşük toksisiteli** ve **ucuz** ilaçlardır. Bu nedenle çeşitli enfeksiyonlarda en tercih edilen ilaçlardandır.
- Klinik kullanıma giren iki doğal penisilin vardır: **Penisilin G** (benzilpenisilin) ve **Penisilin V** (fenoksimetilpenisilin). Doğal penisilinlerdeki birtakım sakıncalar nedeniyle yeni penisilinler geliştirilmiştir. Bu amaçla yapılan gelişmeler:

1. Aside dayanıklı penisilinler yapılması (oral kullanım için)
2. Beta-laktamazlara dayanıklı penisilinler yapılması
3. Spektrumu daha geniş penisilinler yapılması
4. Beta-laktamaz inhibitörleri ile penisilinlerin kombine edilmesi

Penisilinler

Kimyasal Yapı

- Penisilinlerde temel yapı **6-APA**'dır.
- Antibakteriyel etki için 6-APA halkasının bozulmaması gerekir. Temel yapıda bulunan beta-laktam halkası, bakterilerin ürettiği **beta-laktamaz enzimi** tarafından açılır ve **penisiloik asit** türevlerine parçalanır.



6-aminopenisillanik asit (6-APA)

- ❖ Penisiloik asit türevleri antibakteriyel etki göstermez. Bu maddeler vücutta hapten rolü oynarlar; antijenik etki gösterirler.
- ❖ Penisiloik asit türevleri penisilin alerjisinde vücutta penisiline karşı antikor oluşmasından ve alerjik reaksiyon gelişmesinden sorumludur.

Penisilinler

Etki Mekanizmaları

1. Bakterilerin **müreinden** oluşan hücre duvarının sentezini son basamakta (**transpeptidasyon basamağı**) inhibe ederler. Bu basamakta penisilinler, yapıca benzedikleri peptidoglikan zincirinin son kısmına bağlanarak sitoplazmada yerleşim gösteren **penisilin bağlayan proteinler (PBP'ler)** adlı enzim grubuna yarışmalı olarak bağlanır. PBP'ler transpeptidazları katalize eder ve hücre duvarına **çapraz bağlanmayı** sağlar; komşu peptidoglikan zincirlerinin çapraz bağlanmasıyla hücre duvarı zayıflar ve **bakteri hücresi ölür**.
2. **Mürein hidrolaz** enzimini baskılayan inhibitör faktörleri inaktive ederek otoliz sonucu hücre duvarını bozarlar.

Penisilinler

Rezistans

1. Bakteride beta-laktamaz üretimi
2. PBP'lerde deęişiklik sonucu ilaca afinitesinin azalması
3. Bakteri hücre membranının ilaç permeabilitesinin azalması. (Bu durum, gram (+) bakterilerde -etrafında kalın peptidoglikan tabakası bakteri yüzeyine yakın olduęu ve yapısında geniş delikler olduęu için- antibiyotik girişine engel olmazken; gram (-) bakterilerde en dış bileşen lipiddir ve içinde protein yapılı porin kanalları bulunan karmaşık bir yapıdır, bu da antibiyotik girişi için büyük sorun oluşturur.
4. Antibiyotięi hücre dışına atan efflux pompa sistemi varlığı (gram (-) bakterilerde)

Penisilinler

Yan Etkileri

- Oral yoldan yüksek doz kullanımda **bulantı, kusma, diyare, karın ağrısı** yapabilir.
- Tedavi süresi uzunsa bağırsak florasının bozulmasına bağlı olarak **süperenfeksiyon** oluşabilir.
- İm enjeksiyon bölgesinde **ağrı** yapabilir.
- İv infüzyon verileceği zaman **yavaş infüzyon** yapılmalıdır, hızlı yapılması halinde konvülsiyon yapabilir.
- Penisilinler **nörotoksik** ilaçlardır; çok yüksek kan düzeyine ulaştıklarında nöbete neden olabilirler. Ayrıca penisilinler **GABA inhibisyonu** oluşturabilecekleri için epileptik hastalarda dikkatli olunmalıdır.

Penisilinler

Penisilin Alerjisi

- Penisilinler düşük toksisiteli ilaçlardır. Direkt veya yalın toksik etkileri en düşük ilaç grubudur. Fakat alerjik yan etkileri oldukça fazladır.
- Bütün penisilin türleri **alerji** yapma potansiyeline sahiptir (**Penisilin alerjisi**). Ayrıca **çapraz-alerji** durumu vardır; bir penisilin türüne alerjisi olan kişi, diğer penisilin türlerine de alerjiktir.
- **Penisiloidik asit türevleri** alerjiye sebep olan etkindir.
- Penisilinler **4 alerji tipini** de oluşturabilirler. En sık **tip-1 alerjik** reaksiyonlar görülür. Ürtiker, kaşıntı, anjiyoödem gibi hafif belirtiler verir ve genelde **hemen** uygulama sonrası gözlenir.

Penisilinler

Penisilin Alerjisi

- Belirtiler ilaç uygulandıktan dakikalar sonra ortaya çıkar. Bulantı, kusma, karın ağrısı, dudakların, damağın şişmesi, huzursuzluk başlangıçta gözlenen belirtilerdir. Daha sonra bronkospazma bağlı nefes almada zorluk, hisşirtılı solunum ve göğüs sıkışması görülür.
- Akut anafilaksi ile kendini gösteren tehlikeli tip-1 reaksiyon, az görülür, ancak vakaların %10'unda ölüme neden olur.
- Penisilin alerjisine bağlı geç reaksiyonlar (72 saat sonra) en sık gözlenen (%80-90) durumdur. En sık gözlenen belirti ciltte döküntüdür. Nadiren ilaç ateş de olabilir. Penisilin türleri alerjik olmayan kişilerde hafif cilt döküntüsü oluşturabilir, karıştırılmamalıdır.

Penisilinler

Penisilin Alerjisi

- Penisilin alerjisi olan kişiler, sefalosporinlere de alerjik olabilir. Bu nedenle penisilin alerjisi olan hastaya sefalosporin başlanmamalıdır.
- Oral penisilin kullanımında daha nadir alerji gözlenir; iv verilişte daha siktir.
- Alerjik hastalığı olan kişiler pensilin alerjisine daha yatkındır.
- Dozun yüksekliği ve kullanım süresinin uzunluğu alerji potansiyelini artırır.

Penisilinler

Penisilin Alerjisi

Hastaya penisilin başlanmadan önce penisilin alerjisi olup olmadığı mutlaka sorulmalıdır.

Hastanın bilmediği penisilin alerjisi olabilir bu nedenle alerji belirtileri anlatılmalı ve böyle bir durumla karşılaşırsa bir sağlık kuruluşuna başvurması söylenmelidir.

Penisilinlerin Kimyasal Yapılarına Göre Sınıflandırılması

1. Benzilpenisilin (Penisilin G)

2. Fenoksipenisilin (Penisilin V)

3. Stafilokokal beta-laktamazlara dayanıklı penisilinler

4. Aminopenisilinler

5. Karboksipenisilinler

6. Asilüreidopenisilinler

7. Diğer penisilinler

Penisilinler

Antibakteriyel Spektrum

- Penisilinler antibakteriyel spektrumlarına göre 4'e ayrılır:

Dođal Penisilinler

- Penisilin G
- Penisilin V

Antistafilokokal (Penisilinaza Dirençli) Penisilinler

- Metisilin
- Nafsilin
- İzoksazil penisilinler (oksasilin, kloksasilin, dikloksasilin, flukloksasilin)

Geniř Spektrumlu Penisilinler

- Aminopenisilinler (Ampisilin -ön ilaç hali bakampisilin, pivampisilin- Amoksasilin)

Antipsödomonal Penisilinler

- Karboksipenisilinler (karbenisilin, tikarsilin)
- Asilüreidopenisilinler (mezlosilin, piperasilin, azlosilin)

Penisilinler

Antibakteriyel Spektrum

<u>Dođal Penisilinler</u>	<u>Gram (+) koklar</u> (S. pyogenes, S. pneumoniae, enterokoklar), <u>gram (-) koklar</u> (N. Meningitis, N. Gonorrhoeae), <u>gram (+) basiller</u> (B. anthracis, C. diphtheriae, L. Monocytogenes), <u>anaerob bakteriler</u> (peptostreptokoklar, C. perfringens, Actinomyces israelii), Pasteurella multocida, Streptobacillus moniliformis, Spirillum minus, Treponema pallidum, Borrelia burgdorferi
<u>Antistafilokokal Penisilinler</u>	Beta-laktamaz üreten Staphylococcus suşları; MRSA
<u>Geniş spektrumlu Penisilinler</u>	Dođal penisilinlerin etkili olduđu bakterilere ek olarak: H. influenzae, Enterobacteriaceae
<u>Antipsödomonal Penisilinler</u>	Geniş spektrumluların etkili olduklarına ek olarak: P. aeruginosa, B. fragilis, Serratia türleri, Enterobacter türleri, Klebsiella

Penisilinler

ENDİKASYONLARI

- Üst solunum yolu enfeksiyonları
- Alt solunum yolu enfeksiyonları
- Cilt ve yumuşak doku enfeksiyonları
- Santral sinir sistemi enfeksiyonları
- İnfektif endokardit
- Gastrointestinal ve intraabdominal enfeksiyonlar
- İdrar yolu enfeksiyonları
- Cinsel yolla bulaşan hastalıklar
- Kemik ve eklem enfeksiyonları
- Nötropenik hastalarda görülen *Pseudomonas aeruginosa* enfeksiyonları
- Aktinomikozis, antraks, leptospiroz, Vincent anjini ve stomatiti

Penisilinler

- Penisilinlere karşı, bakterilerin ürettiği **beta-laktamaz** enzimleri nedeniyle **direnç** oluşur ve bu direnç tedavinin başarısız olmasına sebep olur. Penisilinlerin etki gücünü artırmak ve spektrumunu genişletmek amacıyla 2 yol izlenmiştir:
 1. Beta-laktamazlara dayanıklı penisilinler geliştirilmesi
 2. Beta-laktamaz inhibitörlerinin geliştirilmesi ve penisilinle kombinasyonlarının üretilmesi.
- Bu amaçla üretilen **beta-laktamaz inhibitörleri:**
- Klavulanik asit, sulbaktam ve tazobaktam, beta-laktam halkası içerirler ancak tek başlarına antibakteriyel etkinlik göstermezler ve belirgin yan etkiler oluşturmazlar. (Sulbaktam kombinasyonda antibakteriyel etkiyi güçlendirir.) Beta-laktamazları inhibe ederler, beta-laktam antibiyotiklerin etkinliğini artırır.

Klavulanik asit
Sulbaktam
Tazobaktam

Penisilin Türleri

PENİSİLİNLER

DOĞAL PENİSİLİNLER

-PENİSİLİN VE DEPO
TÜREVLERİ
-PENİSİLİN V (ASİDE
DAYANIKLI PENİSİLİN)

ANTİSTAFİLOKOKAL PENİSİLİNLER

-METİSİLİN
-NAFSİLİN
-İZOKSAZOLİL
PENİSİLİNLER
(OKSASİLİN,
KLOSASİLİN,
DİKLOKSASİLİN,
FLUKLOKSASİLİN)

GENİŞ SPEKTRUMLU PENİSİLİNLER

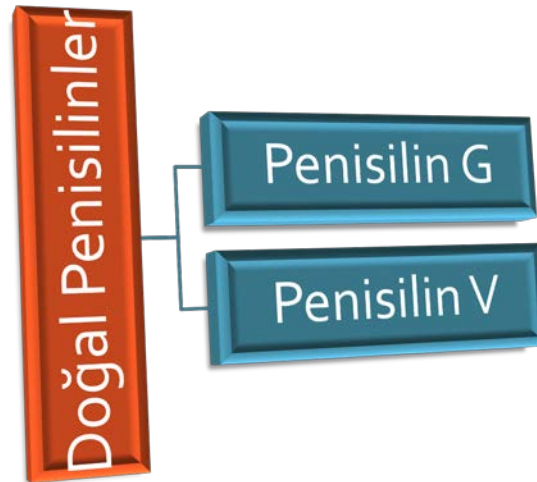
-AMPİSİLİN
(ÖN İLAÇ-
BAKAMPİSİLİN
PİVAMPİSİLİN)
-AMOKSİSİLİN

ANTİPSÖDOMONAL PENİSİLİNLER

-KARBOKSİPENİSİLİNLER
(KARBENİSİLİN, TİKARSİLİN)
-ASİLÜERİDOPENİSİLİNLER
(MEZLOSİLİN, PİPERASİLİN,
AZLOSİLİN)

DOĐAL PENİSİLİNLER

- Dođal olarak üretilen birçok penisilin türlerinden sadece ikisi klinik kullanıma uygun olup günümüzde de kullanılmaktadır: **Penisilin G** ve **Penisilin V**.
- Penisilinlerin **en eskisi** Penisilin G'dir.
- Penisilin G aside dayanıksızdır. **Aside dayanıklı** olan dođal penisilin Penisilin V'dir.



Penisilin G (Benzilpenisilin)

- Penisilin G, sodyum ve potasyum tuzları halinde **kristalize penisilin G** adıyla kullanılır. Suda fazla çözüldüğü için suda solüsyon halinde kullanılır.
- Aşağıda verilen bakterilerin yaptığı enfeksiyonlarda sık tercih edilen ilaçlardandır:

Streptococcus pneumoniae, Grup A streptokoklar (S. pyogenes), Neisseria meningitidis, Gram (+) basiller (Clostridium perfringens, Clostridium tetani, Corynebacterium diphtheriae, Bacillus anthracis), Treponema pallidum, Borrelia burgdorferii, Leptospira icterohaemorrhagica.

- Penisilin G, bazı bakterilerin salgıladığı **beta-laktamazlara** karşı dayanıklı değildir.
- Neisseriae gonorrhoeae, Staphylococcus aureus, Nocordia asteroides, Streptococcus pneumoniae beta-laktamaz salgılaması nedeniyle penisilin G'ye duyarlılıkları azalmış olan bazı bakterilerdendir.

Penisilin G (Benzilpenisilin)

- Mide asidine dayanıklı değildir; çok hızlı parçalanır. Bu yüzden oral kullanılmaz.
- Suda fazla çözündüğü için müstazharlarda toz flakon ve çözücüsü olan su olarak bulunur, kullanmadan önce karıştırılarak sudaki solüsyonu im ve iv şeklinde kullanılır.
- Büyük bölümü böbreklerden elimine edilir.
- Plazma proteinlerine %60 civarında bağlanır.
- Uzun süre etki oluşturmak ve yüksek kan düzeyi elde etmek istendiğinde Penisilin G'nin depo türevleri kullanılır.

Penisilin G Depo Türevleri

- Penisilin G'nin **depo** türevleri, penisilin G'nin **prokain** tuzu veya **benzatin** esteri formundadır. Suda az çözünürler.
- **Prokain-Penisilin G** ve **Benzatin-Penisilin G** suda az çözündükleri için **süspansiyon** oluştururlar. Bu süspansiyon, partiküllerin yavaş çözünmesine ve absorpsiyon süresinin uzamasına neden olur. Bu da etki süresinin **uzun** olmasını sağlar. Sadece **im** kullanılır.
- Prokain-penisilin G, içerdiği **prokain**den dolayı daha fazla alerjik reaksiyona sebep olabilir.

Penisilin G

TÜRKİYE'DE BULUNAN PENİSİLİN G MÜSTAHZARLARI

KRİSTALİZE PENİSİLİN G

- ✓ PENİCİLLİN G POTASYUM ENJ. TOZ 500.000-1.000.000 İÜ
- ✓ PENİSİLİNA IM/IV ENJ. TOZ 1.000.000 İÜ

BENZATİN-PENİSİLİN G

- ✓ BENZAPEN-LA FLAKON 1.200.000-2.400.000 IU
- ✓ DEPOSİLİN 6,3,3 IU ENJ. ÇÖZ. TOZ-1.200.000-2.400.000 IU
- ✓ PENTİN-LA FLAKON 1.200.000 IU

TAKVİYELİ PROKAIN-PENİSİLİN G

- ✓ DEPOSİLİN 6,3,3 IU ENJ. ÇÖZ. TOZ
- ✓ DEVAPEN IM ENJ. ÇÖZ. TOZ 400-800 IU
- ✓ IECILLINE FLAKON 4.000.000-8.000.000 IU
- ✓ PROCAIN PENICILLIN FLAKON 4.000.000-8.000.000 IU

Penisilin V (Fenoksimetilpenisilin)

- **Aside dayanıklı** penisilinlerdendir. **Oral** yolla alındığında biyoyararlanım penisilin G'den daha yüksektir fakat mide-bağırsak kanalından az absorbe edilir.
- Aside dayanıklı penisilinler arasında Türkiye'de üretilen **tek** penisilindir; fenoksipenisilinler grubunun da klinikte kullanılan **tek** üyesidir.
- Gram (+) koklar ve aerobik bakteriler üzerine penisilin G'ye yakın oranda etki ederken; gram (-) koklar ve anaerob bakteriler üzerine penisilin G'den daha **düşük** etki gösterir.
- Plazma proteinlerine **%80** civarında bağlanır.
- Büyük bölümü **karaciğerden** metabolize edilerek elimine edilir.

Penisilin V (Fenoksimetilpenisilin)

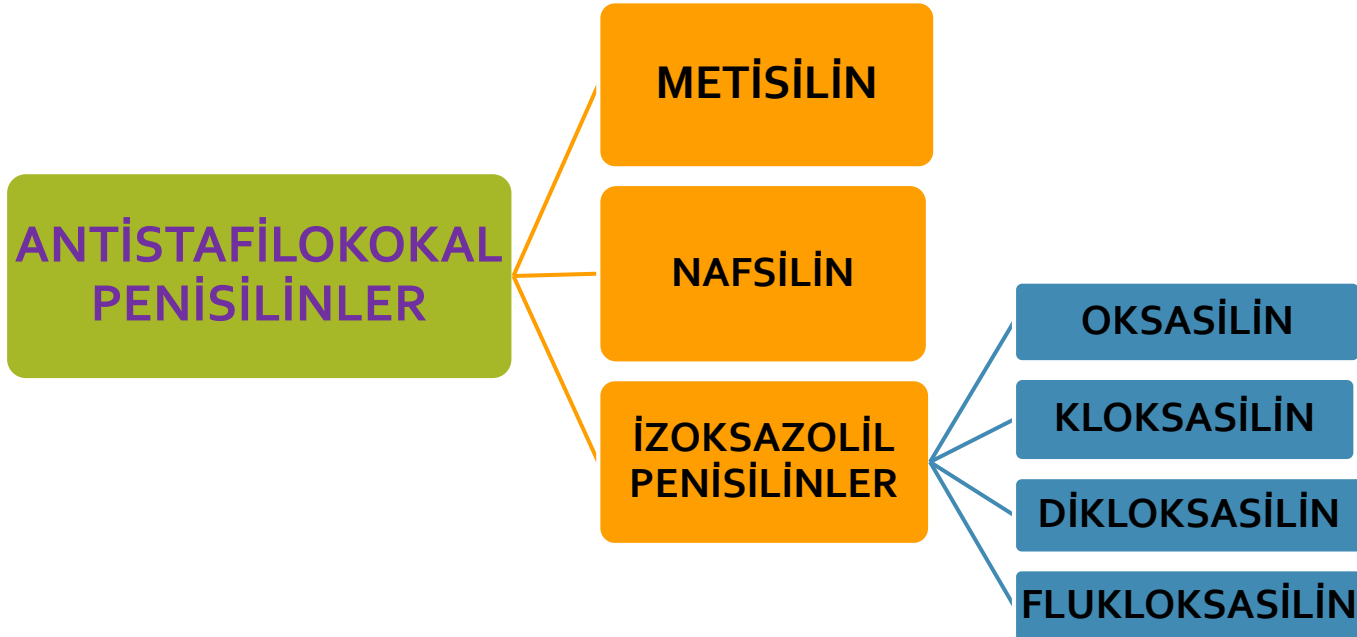
TÜRKİYE'DE BULUNAN PENİSİLİN V MÜSTAHZARLARI

- ✓ PEN-OS 1000 FİLM TABLET 1.000.000 İÜ
- ✓ CLİACİL 1.2 MEGA FİLM TABLET 1.200.000 İÜ
- ✓ PEN-OS 400 ORAL SÜSPANSİYON İÇİN KURUTOZ 400.000 İÜ/5ML
- ✓ CLİACİL ŞURUP HAZIRLAMAK İÇİN KURUTOZ 300.000 İÜ/5ML

Pen-os oral süspansiyon ve tablet aç veya tok alınabilirken, Cliacil oral süspansiyon ve tablet, absorpsiyonu artırmak için aç alınmalıdır.

ANTİSTAFİLOKOKAL PENİSİLİNLER

- Stafilokokal **beta-laktamazlara dayanıklı** penisilinlerdir.
- **Metisilin, Nafsilin ve İzoksazolil penisilinler (Oksasilin, Kloksasilin, Dikloksasilin, Flukloksasilin)** bu gruptadır.



S. aureus suşlarının salgıladığı beta-laktamazlara dayanıklıdır ama E. coli gibi enterik gram (-) bazı basillerin salgıladığı beta-laktamazlara dayanıklı değildir. Hemolitik streptokoklara, pnömokoklara ve Neisserialara penisilin G'den daha düşük olmakla beraber etkilidirler. Sadece beta-laktamaz üreten; penisilin G'ye dirençli S. aureus ve S. epidermidis enfeksiyonlarında kullanımı vardır.

ANTİSTAFİLOKOKAL PENİSİLİNLER

ÖNEMLİ BİLGİLER

- Metisilin dışındakiler aside dayanıklıdır.
- Nafsilinin dışındakiler oral yolla kullanılabilirler.
- Metisilin, nafsilin ve oksasilin im veya iv yolla kullanılabilirler.
- Biyoyararlanımı en yüksek olan flukloksasilindir; bu nedenle oral kullanımda diğerlerine göre üstündür.
- Besinlerle alınması absorpsiyonu azalttığı için aç karnına alınmalıdır.

TÜRKİYE'DE
MÜSTAHZARI
BULUNAN TEK
ANTİSTAFİLOKOKAL
PENİSİLİN
FLUKLOKSASİLİNDİR.

Flukloksasilin

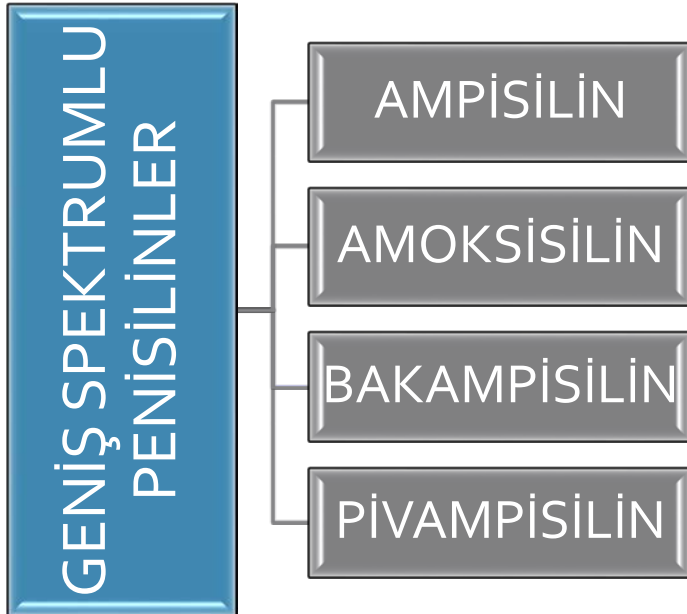
- Oral kullanımda biyoyararlanımı yüksektir fakat besinler absorpsiyonu azaltır bu nedenle **AÇ** karnına kullanılmalıdır.
- Büyük oranda böbreklerden **yavaş** elimine edilir. Eliminasyonu yavaş; etki süresi uzundur.
- Plazma proteinlerine %90 civarında bağlanır.

TÜRKİYE'DE FLUKLOKSASİLİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

PENFLOKS FİLM TABLET 500 MG

GENİŞ SPEKTRUMLU PENİSİLİNLER

- Kimyasal yapıca **aminopenisilinler** grubundakiler geniş spektrumlu penisilinlerdir, aside dayanıklıdır.
- **Ampisilin, Amoksisilin** ve Ampisilinön ön ilaç hali olan **Bakampisilin** ve **Pivampisilin** bu gruptaki penisilinlerdir. Türkiye'de Pivampisilin hariç müstahzarları vardır.



Gram (+) ve (-) koklara karşı penisilin G'ye yakın; antistafilokokal penisilinlerden daha fazla etkilidirler. H. influenzae, E. coli, Proteus mirabilis, Shigella suşlarına etkilidirler. Bazı beta-laktamazlara dayanıksızlardır.

Ampisilin

- Mide-bağırsak kanalından kısmen absorbe edilir ve absorpsiyon besinlerden etkilenir. Tercihen **AÇ** alınması önerilir.
- Absorbe edilen dozun yaklaşık yarısı böbreklerden elimine edilir; **idrardaki konsantrasyon yüksektir**. Geriye kalan kısmın büyük bölümü karaciğerden safra içine atılır; **safradaki konsantrasyon plazmadakinden çok yüksektir**.
- Plazma proteinlerine çok az bağlanır.
- Probenesid, ampisilinin böbreklerden atılımını engelleyerek ampisilinin etki süresini uzatır. Bazı endikasyonlarda bu durumdan yararlanılarak birlikte kullanımı vardır.

Ampisilin

ENDİKASYONLARI

- H. influenzae kaynaklı kronik bronşit akut alevlenmeleri, çocuklarda görülen akut otitis mediada kullanılır.
- E. coli, P. mirabilis, enterococcus kaynaklı üriner enfeksiyonlarda kullanılır.
- Pnömonok ve meningokok kaynaklı menenjit tedavisinde kullanılabilir (Penisilin G daha çok tercih edilir.)
- Enterokokal endokardit tedavisinde kombinasyon içinde kullanılabilir.



Ampisilin sık görülebilen spesifik bir yan tesiri vardır: **Makülopapüler döküntü** oluşturması. Bu durum enfeksiyöz mononükleozlu, kronik lenfatik lösemili, böbrek yetmezliği olan, hiperürisemili ve allopürinol kullanan hastalarda sıklıkla görülür.

Penisilinler içerisinde **en fazla diyareye** sebep olan Ampisilindir.



Ampisilin

TÜRKİYE'DE AMPİSİLİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- AMPİSİNA IM/IV ENJ. TOZ 250-500-1000 MG
- PENBİSİN ENJ. ÇÖZ. TOZ 250-500-1000 MG
- ALFASİLİN TABLET 1000 MG
- AMPİSİLİNA TABLET 1000 MG
- ALFASİLİN KAPSÜL 500 MG
- AMPİSİNA KAPSÜL 500 MG
- AMPİSİNA SÜSP. TOZ 125 MG/5 ML-250 MG/5 ML
- AZOSİLİN TABLET 500 MG/50 MG (ampisilin+fenazopiridin)

Üriner tedaviye özgü

Ampisilin

TÜRKİYE'DE AMPİSİLİN+SULBAKTAM (SULTAMİSİLİN) İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- ALFASİD İM ENJ. TOZ FLAKON 150/125-500/250-1000 MG/500 MG
- ALFASİD İM ENJ. TOZ FLAKON 150/125-500/250-1000 MG/500 MG (+lidokain)
- AMPİSİD İM ENJ. TOZ 250/125- 500/250-1000 MG/500 MG
- AMPİSİD İM ENJ. TOZ 250/125- 500/250-1000 MG/500 MG (+lidokain)
- DEVASİD İM ENJ. TOZ FLAKON 1000 MG/500 MG
- DEVASİD İM ENJ. TOZ FLAKON 1000 MG/500 MG (+lidokain)
- DUOBAK ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 1000 MG/500 MG
- DUOCİD İM/İV FLAKON 100 MG/500 MG
- SULBAKSİT İM/İV ENJ. ÇÖZ. TOZ. 250/125-500/250-100 MG/500 MG
- SULBAKSİT İM ENJ. ÇÖZ. TOZ. 250/125-500/250-100 MG/500 MG (+lidokain)
- SULCİD İM/İV ENJ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 250/125-500/250-100 MG/500 MG
- SULCİD İM ENJ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 250/125-500/250-100 MG/500 MG (+lidokain)

Ampisilin

TÜRKİYE'DE AMPİSİLİN+SULBAKTAM (SULTAMİSİLİN) İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- ALFASİD FİLM TABLET 750 MG
- AMPİSİD FİLM KAPLI TABLET 375-750 MG
- COMBİCİD FİLM TABLET 750 MG
- DEVASİD FİLM TABLET 375 MG
- DUOBAK FİLM TABLET 375-750 MG
- DUOCİD FİLM KAPLI TABLET 375 MG
- SULCİD FİLM KAPLI TABLET 375-750 MG
- SULTAMAT TABLET 375-750 MG
- DUOBAK ORAL SÜSP. TOZ 250 MG/5 ML
- DUOCİD ORAL SÜSP. TOZ 250 MG/5 ML
- SULCİD ORAL SÜSP. TOZ 250 MG/5 ML
- SULCİD PEDİATRİK ORAL SÜSP. TOZ 250 MG/5 ML
- SULTAMAT ORAL SÜSP. TOZ 250 MG/5 ML

Amoksisilin

- Mide bağırsak kanalından **iyi** absorbe edilir. Absorpsiyon besinlerden anlamlı oranda etkilenmez bu nedenle **aç veya tok** alınabilir.
- Absorbe edilen dozun yaklaşık yarısı böbreklerden değişmeden atılırken; kalan kısmın çoğu karaciğerden elime edilir.

Amoksisilin Ampisiline Üstünlüğü:

- ❖ Amoksisilin mide-bağırsak kanalından yaklaşık iki kat fazla oranda (%90) ve daha hızlı absorbe edilir.
- ❖ Aynı dozda oluşturduğu doruk kan düzeyi, ampisilinin yaklaşık iki katıdır ve daha uzun sürelidir.
 - ❖ Safra içindeki konsantrasyonu ampisilinden fazladır.
- ❖ İnterstisyel sıvıya, orta kulak sıvısına, burun sinüs salgısına, balgama ampisilinden daha fazla geçer.

Amoksisilin

ENDİKASYONLARI

- Grup A streptokoklara etkilidir. Çocukluk çağında görülen streptokokal farenjit tedavisinde kullanımı vardır.
- Duyarlı bakteri kaynaklı solunum yolu enfeksiyonları, akut otitis media, üriner enfeksiyonlar ve diğer enfeksiyonlarda kullanılır.

Amoksisilin yan etki olarak diyare yapma potansiyeli ampisilinden daha düşüktür. Çünkü ampisilinden daha fazla absorbe edilir, dolayısıyla amoksisilin, feçeste fazla kalmaz ve kolona fazla erişmez.

Amoksisilin

TÜRKİYE'DE AMOKSİLİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- ALFOXİL TABLET 500-1000 MG
- ATOKSİLİN TABLET 500-1000 MG
- DEVAMOX TABLET 500-1000 MG
- LARGOPEN TABLET 500-1000 MG
- LARGOPEN KAPSÜL 500 MG
- REMOXİL TABLET 500-1000 MG
- ALFOXİL FORTE ORAL SÜSP. TOZ 250 MG/5 ML
- ATOKSİLİN ORAL SÜSP. TOZ 250 MG/5 ML
- LARGOPEN ORAL SÜSP. TOZ 125 MG/5 ML- 200 MG/5 ML
- LARGOPEN FORT ORAL SÜSP. TOZ 400 MG/5 ML
- REMOXİL SÜSP. TOZ 250 MG/5 ML
- NEOAMOX ENJ. FLAKON 1000 MG
- REMOXİL ENJ. ÇÖZ. TOZ 250-500-1000 MG
- HELİPAK TEDAVİ PAKETİ (amoksisilin+klaritromisin+lansoprazol)
- TRİLEVO TEDAVİ PAKETİ (amoksisilin+lansoprazol+levofloksasin)
- TRİO TEDAVİ PAKETİ (amoksisilin+klaritromisin+lansoprazol)

Helicobacter
pylori tedavisi

Amoksisilin

TÜRKİYE'DE AMOKSİSİLİN+KLAVULANİK ASİT İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- AMOKLAVİN-BİD FİLM TABLET 625-1000 MG
- AUGMENTİN-BİD FİLM TABLET 625-1000 MG
- AMOKSİLAV QUICKTAB AĞIZDA DAĞ. TABLET 625-1000 MG
- CROXİLEX BID FİLM TABLET 625-1000 MG
- KLAMOKS BID FİLM TABLET 625-1000 MG
- KLAVON BID FİLM TABLET 1000 MG
- KLAVUNAT FİLM TABLET 625 MG
- KLAVUNAT-BİD FİLM TABLET 1000 MG
- AMOKLAVİN IV ENJ./İNF. ÇÖZ TOZ VE ÇÖZÜCÜ 1000 MG/200 MG
- AUGMENTİN ORAL SÜSP. KURU TOZ SAŞE 400 MG/57 MG

Amoksisilin

TÜRKİYE'DE AMOKSİSİLİN+KLAVULANİK ASİT İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- AKLAV BID FORT SÜSP. TOZ 200 MG/5 ML- 400 MG/5 ML
- AMOKLAVİN ES ORAL SÜSP. TOZ. 600 MG/5 ML
- AMOKLAVİN-BID FORTE ORAL SÜSP. TOZ 400 MG-35 ML/70 ML/100 ML/140 ML
- AMOKLAVİN-BID ORAL SÜSP. TOZ 200 MG-70 ML/100 ML
- AUGMENTİN-BID ORAL SÜSP. TOZ 200 MG/5 ML-400 MG/5 ML
- BIOMENT-BID ORAL SÜSP. TOZ 200/28-400/57
- CROXİLEX ES ORAL SÜSP. TOZ 600 MG/5 ML
- CROXİLEX-BID FORT ORAL SÜSP. TOZ 400 MG/5 ML
- KLAMOKS BID FORT SÜSP. TOZ 200 MG/5 ML- 400 MG/5 ML
- KLAMOKS ES ORAL SÜSP. TOZ 600 MG/5 ML
- KLAVON ES ORAL SÜSP. TOZ 600 MG/5 ML
- KLAVUNAT ES ORAL SÜSP. TOZ 600 MG/5 ML-
- KLAVUNAT-BID FORTE ORAL SÜSP. TOZ 200 MG/5 ML- 400 MG/5 ML

Bakampisilin

- Ampisilinin esteri; ön ilaç formudur. Vücutta ampisiline dönüşerek etki eder.

Ampisiline Göre Avantajları

Daha lipofildir, mide-bağırsak kanalından daha çabuk ve hızlı absorbe edilir.

Kan düzeyleri ampisilinden iki kat yüksektir.

Absorpsiyonu besinlerden etkilenmez.

Ampisiline Göre Dezavantajları

Gastrointestinal yan etkilerin daha sık görülür. (diyare)

Daha pahalıdır.

Ampisilinin benzeri, biyoyararlanımı daha yüksek olan amoksisilinin bulunması.

Bakampisilin

TÜRKİYE'DE BAKAMPİSİLİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- BAKAMSİLİN FİLM TABLET 400 MG
- BAKAMSİLİN FORT TABLET 800 MG

Absorpsiyonu
besinlerden
etkilenmediği
için **aç veya
tok** alınabilir.

ANTİPSÖDOMONAL PENİSİLİNLER

- **Karboksipenisilinler (Karbenisilin, Tikarsilin)** ve **Asilüreidopenisilinler (Mezlosilin, Piperasilin, Azlosilin)** kimyasal yapısına sahip penisilinlerdir.
- Mide-bağırsak kanalından çok az absorbe edilirler; oral kullanımları yoktur sadece parenteral kullanılmaktadırlar.



ANTİPSÖDOMONAL PENİSİLİNLER

- Diğer penisilinlerden antibakteriyel spektrum açısından farkları, grup-1 kromozomal beta-laktamaz sentezleyen ve **diğer penisilinlere dirençli** olan P. aeruginosa, indol (+) Proteus türleri, Enterobacter türleri ve B. fragilise karşı etki etmeleridir.
- Ancak plazmid aracılı beta-laktamazlara dayanıksızdırlar.

- ❑ Pahalı ilaçlardır bu nedenle sadece diğer penisilinlerden farklı olarak etkili olduğu bakteri enfeksiyonlarında kullanılmalıdırlar.
- ❑ En güçlü antipsödomonal etki gösteren penisilinler azlosilin ve piperasilindir.
- ❑ Antipsödomonal penisilinlerle aminoglikozidler arasında kimyasal geçimsizlik vardır; karıştırılmamalı ve farklı yerden, farklı zamanda uygulanmalıdır.

**TÜRKİYE'DE
MÜSTAHZARI BULUNAN
ANTİPSÖDOMONAL
PENİSİLİN
PİPERASİLİNDİR.**

Piperasilin

- Moleküler yapısından dolayı gram (-) bakterilere karşı etkinlikleri yüksektir ancak dezavantajı beta-laktamazlara karşı **dayanıksız** olmasıdır.
- Doza bağımlı kinetik gösterirler bu nedenle doz aşılmamalıdır.
- Bir kısmı böbreklerden değişmeden atılırken bir kısmı da safra içine atılır.

TÜRKİYE'DE PİPERASİLİN+TAZOBAKTAM İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- AVİTAZ İV ENJ. LİYOFİLİZE TOZ FLAKON
- TAZERACİN İV ENJ. İNF. LİYOFİLİZE TOZ FLAKON
- TAZOCİN EF LİYOFİLİZE TOZ FLAKON
- TAZOJECT İV ENJ. LİYOFİLİZE TOZ 2 G/0.25 G
- TAZOJECT İV ENJ. LİYOFİLİZE TOZ
- TAZOPER İV ENJ. LİYOFİLİZE TOZ FLAKON
- TİPRAXİN İV ENJ./İNF. ÇÖZ LİYOFİLİZE TOZ 4 G/0.5 G

Piperasilinin yüksek dozlarıyla **koagülasyonda azalma** görülebilir. Tedavinin 2 haftadan uzun sürmesi halinde sitopeni de gözlenebilir; bu nedenle bu hastalarda **haftada bir kan tahlili** yapılmalıdır.

SEFALOSPORİNLER

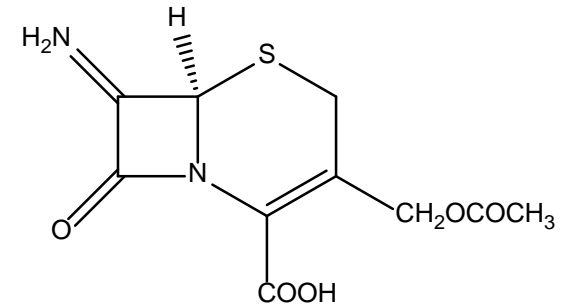
Sefalosporinler

- Sefalosporinler, kimyasal yapı, etki mekanizması ve antibakteriyel spektrum bakımından penisilinlere çok benzeyen beta-laktam antibiyotiklerdir.

Etki Mekanizması: Penisilinler gibi bakteri hücre duvarının peptidoglikan tabaka sentezini transpeptidasyon basamağında inhibe ederek güçlü bakterisid etki gösterirler.

Kimyasal Yapı

- Ana çekirdeğini **7-ASA** oluşturur.
- Ana çekirdeğin yan zincirlerine eklemeler yapılarak yarı sentetik türevler elde edilmiştir.



7-ASA (7-aminosefalosporanik asit)

Sefalosporinler

Rezistans

- Sefalosporinler, penisilinlerle aynı direnç geliştirme mekanizmalarına sahiptir.

1. Bakteride beta-laktamaz üretimi (Bazı beta-laktamazlara penisilinlerden daha direçlidirler)

2. PBP'lerde deęişiklik sonucu ilaca afinitesinin azalması

3. Bakteri hücre membranının ilaç permeabilitesinin azalması. (Bu durum, gram (+) bakterilerde -etrafında kalın peptidoglikan tabakası bakteri yüzeyine yakın olduęu ve yapısında geniş delikler olduęu için- antibiyotik girişine engel olmazken; gram (-) bakterilerde en dış bileşen lipiddir ve içinde protein yapılı porin kanalları bulunan karmaşık bir yapıdır, bu da antibiyotik girişi için büyük sorun oluşturur.

4. Antibiyotięi hücre dışına atan efflux pompa sistemi varlığı (gram (-) bakterilerde)

Sefalosporinler

Farmakokinetik

- Sefalosporinlerin çoğu **aside dayanıksızdır** bu nedenle oral kullanılabilen sefalosporin türü azdır.
- Mide-bağırsak kanalından absorpsiyonunun az olmasının nedeni **hidrofilik** olmasıdır. (Bu durum için yan zincir eklenir veya esterleştirme yapılır.)
- Penisilinlere göre dokulara **daha iyi sokulur**. Özellikle **kemik** dokusuna iyi geçerler.
- Çoğu **böbreklerden** değişmeden atılır. İdrarda yüksek konsantrasyon oluştururlar.
- Eliminasyon yarılanma ömrü penisilinler gibi kısadır.
- **Fetüse** ve **süte** geçerler.

Sefalosporinler

Yan Etkileri

- Kullanıcıların yaklaşık %5'inde alerjik reaksiyonlar görülür: Cilt döküntüsü, ürtiker, eozinofili. Bazen ilaç ateşi de oluşabilir.
- **Penisilin alerjisi** olan kişilerin yaklaşık %5'inde sefalosporine karşı da alerjik reaksiyon oluşabilmektedir.
- Oral kullanımda GIS tahrişe bağlı bulantı, kusma; bağırsakta tahrişe bağlı da diyare gözlenebilir. Diyare görece daha sıktır.
- İm enjeksiyon halinde genellikle **ağrı**; iv enjeksiyon halinde de **flebit** oluşabilir.
- Nadiren **hemolitik anemi** yapabilir.

Sefalosporinler

Yan Etkileri

- Sefalosporin türlerinin atılım yoluna baęlı olarak **nefrotoksik veya hepatotoksik** olabilirler.
- **Süperenfeksiyon** oluşabilir. (Özellikle 2. ve 3. kuşak sefalosporinlerde)
- Aminoglikozidlerle aynı solüsyon içinde kompleks oluşturarak birbirlerini inaktive ederler, bu nedenle **karıştırılmamalıdır**. Ayrıca bu iki ilacın birlikte kullanımının nefrotoksisiteyi artıracığı da unutulmamalıdır.
- **Hemolitik** yan etkiler görülebilir. (Özellikle 3. kuşak sefalosporinler K vitamini eksikliğine yol açabilir.)

Sefalosporinler

BAZI ÖNEMLİ ENDİKASYONLARI

- Solunum yolu enfeksiyonları
- Cilt ve yumuşak doku enfeksiyonları
- İntra-abdominal enfeksiyonlar
- Safra yolu enfeksiyonları
- Kemik ve eklem enfeksiyonları
- Jinekolojik enfeksiyonlar
- Genitoüriner enfeksiyonlar
- Gram (-) basil kaynaklı diğer enfeksiyonlar
- Menenjit
- Gonore
- Cerrahi profilaksi

Sefalosporinler

- Sefalosporinler, antibakteriyel spektrum ve beta-laktamazlara direnç durumlarına göre 5 kuşak halinde sınıflandırılmaktadırlar.
- Enterokoklar, metisiline dirençli koagülaz (-) stafilokoklar ve MRSA **1.-2.-3.-4. kuşak** sefalosporinlere dirençlidir ve bu kuşaklardaki sefalosporinler Clostridium türlerine, Listeria monocytogenes ve Corynebacterium diphteriae gibi gram (+) bakteriler üzerine az etkilidirler.
- İlk dört kuşağın etkileyemediği veya dirençli olduğu bakterilere karşı yeni geliştirilen sefalosporinlerin oluşturduğu **5. kuşak** sefalosporinler etkilidir. Bu yeni sefalosporin türevlerini içeren 5. kuşağın en önemli özelliği metisiline dirençli stafilokoklara ve enterokoklara etkili olmalarıdır.
- Birçok endikasyon için 1. ve 2. kuşak sefalosporinlerin penisilinlere üstünlüğü yoktur. 3. kuşak ve sonrası sefalosporinlerin **spektrumu genişlediği** için endikasyona göre üstünlüğü vardır.

SEFALOSPORİNLER

1.KUŞAK

a) Oral

- Sefaleksın
- Sefadroksil
- Sefaloglisin

b) Parenteral

- Sefalotin
- Sefazolin
- Sefasetril
- Sefapirin
- Sefradin (Or+Par)

2.KUŞAK

a) Oral

- Sefaklor
- Sefuroksim aksetil
- Sefprozil
- Lorakarbef

b) Parenteral

- Sefoksitin
- Sefuroksim sodyum
- Sefamandol
- Sefotetan
- Sefonisid
- Sefmetazol
- Sefotiam
- Sefetamet (Or+Par)

3.KUŞAK

a) Oral

- Sefiksım
- Sefditoren pivoksil
- Sefdinir
- Seftibuten
- Sefpodoksım proksetil

b) Parenteral

- Seftazidim
- Sefoperazon
- Sefotaksim
- Seftizoksım
- Seftriakson
- Sefodizim

c) Antipsödomonal

- Seftazidim
- Sefoperazon

4.KUŞAK

Parenteral

- Sefepim
- Sefpirom

5.KUŞAK

Parenteral

- Seftarolin fosamil
- Seftobiprol medokaril



1. Kuşak Sefalosporinler

- Penisilin G'nin alternatifi ilaçlardır. Kısmen dar spektrumludurlar.
- Gram (+) koklar üzerine güçlü etkinlikleri vardır.

Antibakteriyel Spektrum

- Staphylococcus aureus, S. epidermidis, Streptococcus pyogenes, S. pneumoniae, anaerob streptokoklar gibi gram (+) koklar üzerine güçlü etkinlik gösterirler (MRSA hariç).
- Neisseria türleri ve Moraxella catarrhalis gibi gram (-) koklara ve hastane kaynaklı olmayan E. Coli, K. pneumoniae ve P. mirabilis gibi az sayıda Enterobacteriaceae türler üzerine orta derecede etkilidir.
- Enterokoklar, S. epidermidis, MRSA, B. fragilis dirençlidir.

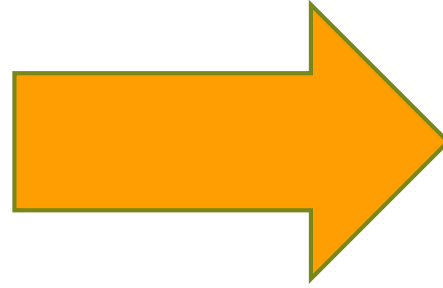
1. Kuşak Sefalosporinler

a) Oral

- Sefaleksın
- Sefadroksil
- Sefaloglisin

b) Parenteral

- Sefalotin
- Sefazolin
- Sefasetril
- Sefapirin
- Sefradin (Or+Par)



TÜRKİYE'DE MÜSTAHZARI BULUNAN 1. KUŞAK SEFALOSPORİNLER

Oral

- SEFALEKSİN
- SEFADROKSİL

Parenteral

- SEFAZOLİN

Oral

Kullanım alanları farenjit ve otitis media dahil üst solunum yolu enfeksiyonları, cilt ve yumuşak doku enfeksiyonları ve üriner sistem enfeksiyonlarıdır.

Parenteral

Başlıca cerrahi profilaksi amacıyla kullanılır.

Sefaleksin

- **Oral** sefalosporinler arasında en fazla kullanılanlardan biridir.
- **Tam** absorbe edilir, besinler absorpsiyon oranını deęiřtirmez fakat **geciktirir**.
- Plazma proteinlerine **çok az** baęlanır.
- Yaklařık %90'ı **böbreklerden** deęiřmeden atılır; idrarda konsantre edilir.
- H. influenzae'ya karřı etkinlięi düřüktür; solunum yolu enfeksiyonlarında ve otitis mediada kullanımı tavsiye edilmez.

Sefaleksín

TÜRKİYE'DE SEFALEKSİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- BİLFASİN FİLM KAPLI TABLET 1 G
- MAKSİPOR FİLM TABLET 500 MG- 1 G
- SEF FİLM KAPLI TABLET 500 MG- 1 G
- MAKSİPOR ORAL SÜSP. KURU TOZ 250 MG/5 ML
- SEF ORAL SÜSP. TOZU 250 MG/5 ML- 500 MG/5 ML

Sefadroksil

- Uzun etkili oral sefalosporinlerdendir.
- Mide-bağırsak kanalından **hızlı** absorbe edilir.
- Yaklaşık %90'ı **böbreklerden** değişmeden atılır.
- Plazma proteinlerine çok az bağlanır.

TÜRKİYE'DE SEFADROKSİL İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- CEFRADUR TABLET 1000 MG
- CEFRADUR KAPSÜL 500 MG

Sefazolin

- Plazma proteinlerine **en fazla bağlanan** sefalosporindir.
- Aynı dozda parenteral olarak verilen diğer sefalosporinlere kıyasla daha yüksek plazma konsantrasyonu sağlar. Ancak çoğu proteinlere bağlı olduğu için serbest plazma konsantrasyonunda belirgin bir üstünlüğü yoktur.
- 1. kuşak sefalosporinler arasında eliminasyon yarılanma ömrü **en uzun olandır**.
- **Cerrahi profilakside** diğer sefalosporinlere tercih edilir. Protez implantasyonu, cerrahi girişimler için sıklıkla tercih edilir. (MRSA'nın potansiyel patojen olduğu durumlarda önerilmez.)
- Çoğu böbreklerden atılırken bir kısmı karaciğerden safra içine atılır. Safradaki düzey plazmadakinin yaklaşık **7** katıdır.

Sefazolin

TÜRKİYE'DE SEFAZOLİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- BEFAZOL IM ENJ. ÇÖZ. HAZ. İÇİN TOZ VE ÇÖZÜCÜ 500 MG-1000 MG (+lidokain)
- BEFAZOL IM/IV ENJ. ÇÖZ. HAZ. İÇİN TOZ VE ÇÖZÜCÜ 500 MG-1000 MG
- CEFAMEZİN IM/IV STERİL ENJ. TOZ FLAKON 1000 MG
- CEZOL IM ENJ. TOZ FLAKON 500 MG- 1000 MG (+lidokain)
- CEZOL IM/IV ENJ. TOZ FLAKON 1000 MG
- EQİZOLİN IM ENJ. TOZ 250-500-1000 MG (+lidokain)
- EQİZOLİN IM/IV ENJ. TOZ 250-500-1000 MG
- İESPOR IM ENJ. ÇÖZ TOZ 250-500-1000 MG (+lidokain)
- İESPOR IM/IV ENJ. ÇÖZ TOZ 250-500-1000 MG
- MAXİCİLİN IM/IV ENJ. TOZ FLAKON 1000 MG
- SEFAZOL IM ENJ. TOZ FLAKON 250-500-1000 MG (+lidokain)
- SEFAZOL IM/IV) ENJ. TOZ FLAKON 250-500-1000 MG
- VANSEF IM ENJ. ÇÖZ .TOZ FLAKON 250-500-1000 MG (+lidokain)
- VANSEF IM/IV ENJ. ÇÖZ .TOZ FLAKON 250-500-1000 MG

2. Kuşak Sefalosporinler

- 1. kuşak sefalosporinlerin yapısı üzerinde deęişiklikler yapılarak, beta-laktamazlara biraz daha dayanıklı; spektrumu daha geniş olan türevleridir.

**Antibakteriyel
Spektrum**

- 1. Kuşak sefalosporinlerin spektrumuna ek olarak: Bazı Enterobacter alt-türleri, indol (+) Proteus türleri ve H. influenzae bakterilerini de içermektedir.
- Penisilinlere dirençli olan suşlar dahil gonokoklara 1. kuşaktan daha etkilidirler.

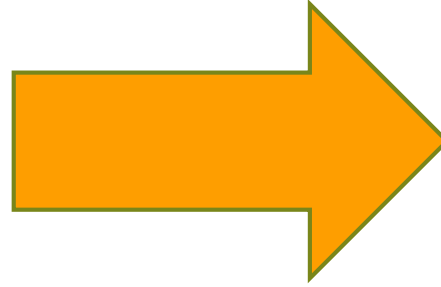
2. Kuşak Sefalosporinler

a) Oral

- Sefaklor
- Sefuroksim aksetil
- Sefprozil
- Lorakarbef

b) Parenteral

- Sefoksitin
- Sefuroksim sodyum
- Sefamandol
- Sefotetan
- Sefonisid
- Sefmetazol
- Sefotiam
- Sefetamet (Or+Par)



TÜRKİYE'DE MÜSTAHZARI BULUNAN 2. KUŞAK SEFALOSPORİNLER

Oral

- SEFAKLOR
- SEFUROKSİM AKSETİL
- SEFPROZİL

Parenteral

- SEFUROKSİM SODYUM

Oral

Başlıca solunum yolu enfeksiyonlarını tedavisinde kullanılırlar.

Parenteral

Solunum yolu enfeksiyonlarının tedavisinde ve katarakt cerrahisi sonrası profilakside kullanılır.

Sefaklor

- Spektrumu diğer oral sefalosporinlere benzer fakat **gram (-) basiller** üzerine daha fazla etkilidir.
- Mide-bağırsak kanalından **sefaleksine göre daha az** absorbe edilir. (Sefaleksin-1. kuşak oral sefalosporin)
- Besinler absorpsiyonu yavaşlatır fakat absorbe edilen miktarı **değiştirmezler.**
- Böbreklerden değişmeden **hızlı** elimine edilirler.
- En önemli kullanım yeri ampisiline dirençli H. influenzae kaynaklı **otitis media** tedavisidir.

Sefaklor

TÜRKİYE'DE SEFAKLOR İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- CEC EFERVESAN TABLET 250-500-1000 MG
- CEFEC EFERVESAN TABLET 1000 MG
- SANOCEF MR FİLM TABLET 375- 750 MG
- CECLOR ORAL SÜSP. GRANÜL 125 MG/5 ML- 250 MG/5 ML
- SANOCEF ORAL SÜSP. KURU TOZ 125 MG/5 ML- 250 MG/5 ML

TÜRKİYE'DE SEFAKLOR+KLAVULANİK ASİT İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- SEFKLAV EFERVESAN TABLET 250 MG/62.5 MG- 1000 MG/125 MG

Sefaklorun **MR** formu **TOK** karnına alınmalıdır. Aç karnına kullanım halinde biyoyararlanım düşer ve daha düşük plazma konsantrasyonu oluşur.

Yemekten 1 saat sonra alımda biyoyararlanım %90'ın üzerinde; aç karnına alımda ise %77 bulunmuştur.

Sefuroksim Aksetil

- Parenteral kullanılan sefuroksimin aksetil **esteridir; ön-ilaçtır.**
- Mide-bağırsak kanalından **yeterli** derecede absorbe edilir; absorpsiyondan sonra sefuroksime dönüşerek etki gösterir.
- Sefalosporin esterleri **TOK** karnına alındığında absorpsiyon artar.
- Büyük ölçüde **böbreklerden** elimine edilir.
- 2. kuşak oral sefalosporinler arasında S. pneumoniae, H. influenzae, M. catarrhalis kaynaklı hastane dışı akut pnömonilerin tedavisinde en optimal olan sefalosporindir.

Sefuroksim Aksetil

TÜRKİYE'DE SEFUROKSİM AKSETİL İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- AKSEF FİLM TABLET 500 MG
- CEFAKS FİLM TABLET 250-500 MG
- CEFUROL FİLM KAPLI TABLET 500 MG
- ENFEXİA FİLM TABLET 250-500 MG
- İNCEPTUM FİLM TABLET 500 MG
- POWERCEF FİLM KAPLI TABLET 500 MG
- SEFAKTİL FİLM TABLET 500 MG
- SEFUROKS FİLM KAPLI TABLET 250- 500 MG
- ZİNNAT FİLM TABLET 250-500 MG
- CEFAKS ORAL SÜSP. GRANÜL 125 MG/5 ML-250 MG/5 ML
- SEFUROKS ORAL SÜSP. KURU TOZ 125 MG/5 ML
- ZİNNAT FORTE SÜSP. GRANÜL 125 MG/5 ML-250 MG/5 ML

TOK
karnına
alınmalıdır!

Sefprozil

- Oral yoldan verilmesiyle birlikte hızlıca absorbe edilir. Besinler absorpsiyonu etkilemez.
- Büyük kısmı böbreklerden atılır.

TÜRKİYE'DE SEFPROZİL İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- CEFNOR EFERVESAN TABLET 500 MG
- ERASEF FİLM KAPLI TABLET 500 MG
- SEROL FİLM KAPLI TABLET 500 MG
- SEROZİL FİLM KAPLI TABLET 500 MG
- ULTRACEF EFERVESAN TABLET 500 MG
- ZİLCEF FİLM KAPLI TABLET 500 MG
- ERASEF ORAL SÜSP. TOZ 250 MG/5 ML
- SEROL ORAL SÜSP. TOZ 250 MG/5 ML
- ULTRACEF ORAL SÜSP. TOZ 250 MG/5 ML
- ZİLCEF ORAL SÜSP. KURU TOZ 250 MG/ 5ML

Sefuroksim Sodyum

- **Antistafilokokal** etkinliđi sefalotinden dūşüktür fakat **antipnömokokal** etkinliđi daha yüksektir. (Sefalotin-1. kuşak parenteral sefalosporin)
- **BOS**'a fazla geçer bu nedenle çocuklarda menenjitte kullanılabilir.
- Plazma proteinlerine **az** bağlanır.
- Sefuroksim, sefuroksim sodyum tuzu halinde **parenteral** olarak kullanılırken; Sefuroksimin aksetil esteri oral olarak kullanılır.
- Büyük oranda deđişmeden **böbreklerden** atılır.

Sefuroksim Sodyum

TÜRKİYE'DE SEFUROKSİM SODYUM İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- AKSEF IM/IV ENJ. TOZ FLAKON 750 MG
- AKSEF IM ENJ. TOZ 750 MG (+lidokain)
- AVİFUR IM/IV ENJ. TOZ FLAKON 250-750 MG
- CEFAXS IV/IM ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 250-750 MG
- CEFAXS IM ENJ. TOZ 250-500 MG (+lidokain)
- CEFROKS IM/IV RNJ. TOZ FLAKON 250-750 MG
- CEFTOP IM/IV ENJ. TOZ FLAKON 750 MG-1.5 G
- CEFUROL IM/IV ENJ. ÇÖZ. TOZ 250-750 MG
- CEFUROL IM ENJ. ÇÖZ. TOZ 250-750 MG (+lidokain)
- CEFUROL IV ENJ. ÇÖZ. TOZ 1.5 G
- ENFEXİA IM ENJ. TOZ FLAKON 750 MG (+lidokain)
- FUROXİMED IM ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 750 MG (+lidokain)

Sefuroksim Sodyum

TÜRKİYE'DE SEFUROKSİM SODYUM İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- MULTİSEF IM ENJ. TOZ FLAKON 250-500-750 MG (+lidokain)
- MULTİSEF IM/IV ENJ. TOZ FLAKON 250-750 MG
- SEFFUR IM ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 250-750 MG (+lidokain)
- SEFFUR IM/IV ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 250-750 MG
- SEFFUR IV ENJ. TOZ FLAKON 1.5 G
- TUGENS IM ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 25-750 MG
- TUGENS IM/IV ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 250-750 MG
- ZANNACEF IM ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 750 MG (+lidokain)
- ZANNACEF IM/IV ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 750 MG
- ZİNNAT IM/IV ENJ. FLAKON 750 MG
- APROKAM İNTRAKAMERAL ENJ. ÇÖZ. TOZ 50 MG
- CEFEYE İNTRAKAMERAL ENJ. ÇÖZ. HAZ. TOZ. 50 MG

3. Kuşak Sefalosporinler

- Beta-laktamazlara 2. kuşaktan daha dayanıklıdırlar ve spektrumları daha geniştir.

Antibakteriyel Spektrum

- H. influenzae, Neisseria ve Enterobacteriaceae türlerine 2. kuşaktan daha etkilidirler.
- Bazı üyeleri P. aeruginosa ve diğer gram (-) bakterilere daha etkilidir.
- MRSA ve enterokoklara etkili değildir.
- Gram (-) bakterilerin ürettiği genişlemiş spektrumlu (kromozomal grup-1 ve plazmid aracılı) beta-laktamazlara duyarlıdır.

3. Kuşak sefalosporinler bağırsak mikroflorasını azaltarak K vitamini eksikliği yapabilir; protrombin zamanını uzatabilirler. Riskli kişilerde, beslenmesi bozuk olanlarda, hemorajili hastalarda dikkatli olunmalıdır.

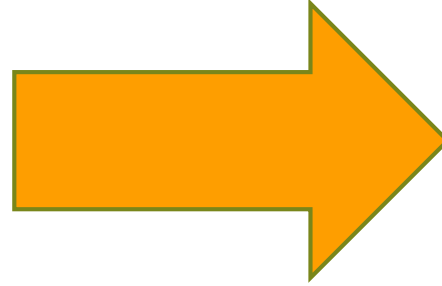
3. Kuşak Sefalosporinler

a) Oral

- Sefiksim
- Sefditoren pivoksil
- Sefdinir
- Seftibuten
- Sefpodoksım proksetil

b) Parenteral

- Seftazidim
- Sefoperazon
- Sefotaksım
- Seftizoksım
- Seftriakson
- Sefodizim



TÜRKİYE'DE MÜSTAHZARI BULUNAN 3. KUŞAK SEFALOSPÖRİNLER

Oral

- SEFİKSİM
- SEFDİTOREN PİVOKSİL
- SEFDİNİR
- SEFTİBUTEN
- SEFPODOKSİM PROKSETİL

Parenteral

- SEFTAZİDİM
- SEFOPERAZON
- SEFOTAKSİM
- SEFTRİAKSON

Antipsödomonal

Oral

Genelde alt ve üst solunum yolu enfeksiyonlarında, idrar yolu enfeksiyonlarında kullanılırlar.

Parenteral

Klinikte önemli bir yere sahiptir. Genellikle hastane içine gelişen ve dirençli gram (-) bakteri kaynaklı enfeksiyonların tedavisinde kullanılırlar.

Sefiksim

- **Uzun etkili** oral sefalosporindir.
- Beta-laktamlara sefalordan (2. kuşak oral sefalosporin) daha dayanıklıdır.
- Mide-bağırsak kanalından **yavaş** absorbe olur. Besinler absorpsiyon hızını etkiler; miktarını deęiştirmez.
- Büyük oranda **böbreklerden** elimine edilir.
- S. pneumoniae, H. influenzae, M. catarrhalis, Neisseria ve birçok enterik gram (-) bakterilere etki eder. Stafilokoklara etkinlięi düşüktür.
- Üst solunum yolu enfeksiyonları, E. coli ve P. mirabilis kaynaklı komplikasyonsuz üriner enfeksiyonlar, gonore ve tifo tedavisinde endikedir.

Sefiksım

TÜRKİYE'DE SEFİKSİM İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- CEFDİA FİLM KAPLI TABLET 400 MG
- CEPİİX FİLM TABLET 400 MG
- FİİEF DT DAĞILABİLİR TABLET 400 MG
- FİİEF FİLM TABLET 400 MG
- MOLCEF FİLM KAPLI TABLET 400 MG
- SUPRAX DT DİSPERSE OLABİLEN TABLET 400 MG
- SUPRAX FİLM KAPLI TABLET 400 MG
- ZİMAKS FİLM TABLET 400 MG
- CEPİİX PEDİATRİK SÜSP. TOZ 100 MG/5 ML
- FİİEF PEDİATRİK ORAL SÜSP. TOZ 100 MG/5 ML
- MOLCEF ORAL SÜSP. KURU TOZ 100 MG/5 ML
- SUPRAX PEDİATRİK ORAL SÜSP. TOZ 100 MG/5 ML
- ZİMAKS ORAL SÜSP. KURU TOZ 100 MG/ 5 ML

TÜRKİYE'DE SEFİKSİM+KLAVULANİK ASİT İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- MOLCEF PLUS FİLM KAPLI TABLET 400
MG/125 MG
- MOLCEF PLUS ORAL SÜSP. KURU TOZ 100
MG/5 ML-200 MG/5 ML

Sefditoren Pivoksil

- Sefalosporin **esteridir**; bir **ön ilaçtır**. Absorpsiyon sonrası sefditorene dönüşerek etki gösterir.
- Sefalosporin esterleri **TOK** karnına alındığında biyoyararlanımları artar.
- Plazma proteinlerine **fazla** bağlanır (**%88**).
- Büyük oranda **böbreklerden** elimine edilir.
- Kronik bronşitin akut alevlenmeleri, diş enfeksiyonları, toplum kaynaklı pnömoni, farenjit, tonsilit, cilt enfeksiyonlarında endikedir.

TÜRKİYE'DE SEFDİTOREN PİVOKSİL İÇEREN MÜSTAHZARLAR

CEFİTEN FİLM KAPLI TABLET 200-400 MG

TOK karnına alınmalıdır.

Sefdinir

- Besinler mide-bağırsak kanalından absorpsiyonunun hız ve kapsamını anlamlı oranda **etkilemez**. Plazma proteinlerine **%60-70** oranında bağlanır. Büyük oranda **böbreklerden** atılır.
- Üst solunum yolu enfeksiyonları, toplum kaynaklı pnömoni, kronik bronşitin akut alevlenmeleri ve komplikasyonsuz cilt enfeksiyonlarında kullanılır.

TÜRKİYE'DE SEFDİNİR İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- CEFDİFİX FİLM KAPLI TABLET 600 MG
- CEFTİNEX FİLM KAPLI TABLET 300-600 MG
- CEMPES FİLM KAPLI TABLET 600 MG
- CLASEM FİLM KAPLI TABLET 600 MG
- ELUCEF EFERVESAN TABLET 300 MG
- ENCEF FİLM KAPLI TABLET 600 MG
- TAMCEF EFERVESAN TABLET 600 MG
- TRİCEF FİLM KAPLI TABLET 300 MG

Sefdinir

TÜRKİYE'DE SEFDİNİR İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- CEMPES KAPSÜL 300 MG
- CLASEM KAPSÜL 300 MG
- ENCEF KAPSÜL 300 MG
- MENACEF KAPSÜL 300 MG
- NUAX KAPSÜL 300 MG
- RODİNİR KAPSÜL 300 MG
- SEFPEN KAPSÜL 300 MG
- TAMCEF KAPSÜL 300 MG
- CEFDİFİX ORAL SÜSP. TOZ 125 MG/5 ML-250 MG/5 ML
- CEFTİNEX ORAL SÜSP. 125 MG/5 ML-250 MG/5 ML
- CEMPES ORAL SÜSP. TOZ 125 MG/5 ML-250 MG/5 ML
- CLASEM ORAL SÜSP. TOZ 125 MG/5 ML-250 MG/5 ML
- ELUCEF ORAL SÜSP. TOZ 125 MG/ 5ML-250 MG/ 5ML
- ENCEF ORAL SÜSP. TOZ 125 MG/5 ML-250 MG/5 ML
- MENACEF ORAL SÜSP. TOZ 125 MG/5 ML-250 MG/5 ML
- RODİNİR ORAL SÜSP. TOZ 125 MG/5 ML-250 MG/5 ML
- TAMCEF ORAL SÜSP. TOZ 125 MG/5 ML-250 MG/5 ML
- TRİCEF ORAL SÜSP. TOZ 125 MG/5 ML-250 MG/ 5 ML

TÜRKİYE'DE SEFDİNİR+KLAVULANİK ASİT İÇEREN MÜSTAHZARLAR

CEFBİR PLUS ORAL SÜSP. TOZ 125 MG/5 ML

Oral süspansiyon formunun biyoyararlanımı kapsül formuna göre **%120**'dir.

Seftibuten

- Mide-bağırsak kanalından **hızla** absorbe olur. Besinlerle birlikte kullanım biyoyararlanımı artırır.
- Büyük oranda böbreklerden elimin edilir.

TÜRKİYE'DE SEFTİBUTEN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- WINCEF FİLM KAPLI TABLET 200-400 MG
- WINCEF ORAL SÜSP. KURU TOZ 90 MG/5 ML- 180 MG/5 ML

Sefpodoksim Proksetil

- Sefalosporin **esteridir; ön ilaçtır**. Sistemik dolaşımında sefpodoksime dönüştürülerek etki gösterir.
- Sefalosporin esteri olduğu için besinlerle birlikte alındığında absorpsiyon hızı **artar**.
- Absorpsiyon hızı ve derecesi **doza bağımlıdır**.
- Büyük kısmı **böbreklerden** değişmeden atılır. (%80)
- Plazma proteinlerine **az** bağlanır (%20 civarı).

Sefpodoksım Proksetil

TÜRKİYE'DE SEFPODOKSİM PROKSETİL İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- ECSERY FİLM KAPLI TABLET 100-200 MG
- İNFEX FİLM TABLET 100-200 MG
- İNFEX MR FİLM KAPLI TABLET 400 MG
- PODORA FİLM KAPLI TABLET 200 MG
- SEFPODO FİLM KAPLI TABLET 200 MG
- SEFSİDAL FİLM TABLET 100-200 MG
- SEFTECH FİLM TABLET 200 MG
- ECSERY ORAL SÜSP. TOZ 100 MG/5 ML
- İNFEX ORAL SÜSP. KURU TOZ 40 MG/5 ML-100 MG/5 ML
- SEFSİDAL ORAL SÜSP. GRANÜL 50 MG/5 ML-100 MG/5 ML

TÜRKİYE'DE SEFPODOKSİM PROKSETİL+ KLAVULANİK ASİT İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- TEXEF PLUS FİLM KAPLI TABLET

TOK karnına alınmalıdır.

Seftazidim

- **ANTİPSÖDOMONAL** etki gösterir. Antipsödomonal etki gücü **en yüksek** sefalosporindir.
- GIS kanaldan absorbe olmaz; parenteral kullanılır.
- **BOS'a** iyi geçer ve psödomonal menenjitte **ilk tercih** edilen ilaçlardandır.
- Başlıca böbreklerden değişmeden elimine edilir.
- P. aeruginosa suşlarında son zamanlarda ciddi **direnç** gelişmiştir.

TÜRKİYE'DE SEFTAZİDİM İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- İESETUM IV ENJ. ÇÖZ. TOZ 2 G
- İESETUM IM/IV ENJ. ÇÖZ. TOZ 500 MG-1 G
- ZİDİM IM/IV ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 500 MG-1 G
- ZAVİCEFTA İNF. ÇÖZ. TOZ 2 G/0.5 G

Seftazidim+**Avibaktam** içermektedir. Avibaktam, yeni geliştirilen bir beta-laktamaz inhibitörüdür.

Sefoperazon

- **ANTİPSÖDOMONAL** etkilidir. P. aeruginosa'ya etki gücü olarak seftazidimden sonra gelir.
- Yarılanma ömrü diğer sefalosporinlerin çoğundan **uzundur**.
- Plazma proteinlerine **fazla** bağlanır (%90).
- **BOS'a** yeterince geçemez; menenjit tedavisinde kullanılamaz.
- Diğer sefalosporinlerden farklı olarak **karaciğerden safraya atılır** ve enterohepatik siklusa girer. Safradaki konsantrasyon plazmadakinin **20** katıdır; safra yolu tıkalı olsa bile yeterli konsantrasyona ulaşır.
- Nozokomiyal pnömoni, intraabdominal enfeksiyonlar, cerrahi enfeksiyonlar, tıkanmalı safra yolu enfeksiyonları, cilt ve yumuşak doku enfeksiyonlarında endikedir.
- En sık **diyare** yapan sefalosporinlerdendir.

Sefoperazon

TÜRKİYE'DE SEFOPERAZON İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- CEFOBID IM/IV FLAKON 0.5- 1 -2 G

TÜRKİYE'DE SEFOPERAZON+SULBAKTAM İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- CEFPERAZON IM ENJ. TOZ FLAKON 1000 MG/1000 MG (+lidokain)
- CEFPERAZON IM/IV ENJ. TOZ FLAKON 1000 MG/1000 MG- 2000 MG/1000 MG
- PRİMASEF IM/IV ENJ. TOZ FLAKON 500 MG/500 MG
- SEFBAKTAM IM/IV ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 1000 MG/1000 MG
- SULPERAZON IM/IV ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 1000 MG/1000 MG
- SULZON IM/IV ENJ. ÇÖZ. TOZ 1000 MG/1000 MG- 2000 MG/1000 MG
- SULZON İM ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 1000 MG/1000 MG (+lidokain)

Sefotaksim

- Tıpta **ilk** kullanılan 3. kuşak sefalosporindir.
- Antipsödomonal **DEĞİLDİR**.
- Antistafilokokal olarak kullanılamaz.
- BOS'a **en fazla** geçenlerden biridir; **menenjit** tedavisinde tercih edilir.
- Plazma proteinlerine **%40** civarında bağlanır.
- Karaciğerde %30-50 oranında metabolize edilir, geri kalan kısmı böbreklerden değişmeden atılır.

Sefotaksim

TÜRKİYE'DE SEFOTAKSİM İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- BETAKSİM İM/İV ENJ. TOZ FLAKON 500-1000 MG
- EQITAX İM/İV ENJ. TOZ FLAKON 500-1000 MG
- EQITAX İN ENJ. TOZ FLAKON 2000 MG
- İEFORAN ENJ. ÇÖZ. TOZ 500-1000 MG
- SEFOTAK STERİL FLAKON 500 MG
- TAKSİDEM İM/İV ENJ. TOZ FLAKON 500-1000 MG

Seftriakson

- Antipsödomonal **DEĞİLDİR**.
- Eliminasyon yarılanma ömrü **en uzun olan** sefalosporindir (8 saat).
- BOS'a **en fazla** geçenlerden biridir; **menenjit** tedavisinde tercih edilir.
- Plazma proteinlerine **fazla** bağlanır (%90).
- Kısmen karaciğerden kısmen de böbreklerden atılır.
- Bağırsak florasını bozmasından dolayı diğer sefalosporinlere göre daha sık **diyare** yapar. Ayrıca safra kesesinde **psödolitiazis (çökelti, safra çamuru)** yapabilir. Tedavi bittikten sonra **2 ay** içinde çökelti kaybolur.

Seftriakson

TÜRKİYE'DE SEFTRİAKSON İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- AVİSEF İV ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 0.5-1 G
- AVİSEF İM ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 0.5-1 G (+lidokain)
- CEFAMED İM/İV ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 0.5-1 G
- CEFAMED İM ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 0.5-1 G (+lidokain)
- CEFORCE İM ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 0.5 -1 G (+lidokain)
- CEFORCE İV ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 0.5 -1 G
- CEFRİDEM İM ENJ. TOZ FLAKON 0.5-1 G (+lidokain)
- CEFRİDEM İV ENJ. TOZ FLAKON 0.5-1-2 G
- CEPHAXON ENJ. FLAKON İM 0.5-1 G (+lidokain)
- CEPHAXON ENJ. FLAKON İV 0.5-1 G
- DESEFİN İM FLAKON 0.5-1 G (+lidokain)
- DESEFİN İV FLAKON 1 G
- EQİCEFT İM ENJ. ÇÖZ. TOZ 0.5-1 G (+lidokain)
- EQİCEFT İV ENJ. ÇÖZ. TOZ 0.5-1 G
- FORSEF İM ENJ. TOZ FLAKON 0.5-1 G (+lidokain)
- FORSEF İV ENJ. TOZ FLAKON 1 G

Seftriakson

TÜRKİYE'DE SEFTRİAKSON İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- İESEF İM ENJ. ÇÖZ. TOZ 0.5-1 G (+lidokain)
- İESEF İV ENJ. ÇÖZ. TOZ 0.5-1 G
- NEVAKSON İM ENJ. TOZ FLAKON 0.5-1 G (+lidokain)
- NEVAKSON İV ENJ. TOZ FLAKON 0.5-1 G
- NOVOSEF İM ENJ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 0.5-1 G (+lidokain)
- NOVOSEF İV ENJ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 0.5-1 G
- ONCEFT İM ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 0.5-1 G (+lidokain)
- ONCEFT İV ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 0.5-1 G
- ROTACEF İM ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 0.5-1 G (+lidokain)
- ROTACEF İV ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 2 G
- ROTACEF İM/İV ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 1 G
- TREGS İM ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 0.5-1 G (+lidokain)
- TREGS İV ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 0.5-1 G
- UNACEFİN İM ENJ. TOZ FLAKON 0.5-1 G (+lidokain)
- UNACEFİN İV ENJ. TOZ FLAKON 0.5-1 G

4. Kuşak Sefalosporinler

- Hem **antipsödomonal** etki gösterir, hem de **beta-laktamazlara dayanıklıdır**.
- En önemli özelliği **dengeli gram (+) ve gram (-)** etkinlik göstermesidir.

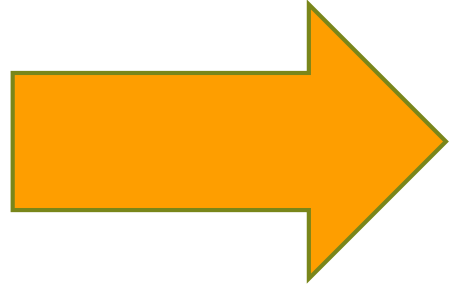
**Antibakteriyel
Spektrum**

- Gram (-) bakterilerin PBP'lerine yüksek afinite gösterir; Enterobacteriaceae, P. aeruginosa, H. influenzae ve Neisseria türlerine etkilidir.
- Gram (+) bakterilerin de PBP'lerine yüksek afinite gösterir; metisiline duyarlı S. aureus, pensiline duyarlı S. pneumoniae ve diğer streptokoklara etkilidirler.
- MRS ve B. fragilise belirgin etkinlikleri yoktur.
- Plazmid aracılı bazı beta-laktamazlara direnç görülebilmektedir.

4. Kuşak Sefalosporinler

Parenteral

- Sefepim
- Sefpirom



TÜRKİYE'DE MÜSTAHZARI BULUNAN 4. KUŞAK SEFALOSPORİN

- Parenteral
- **SEFEPİM**

Parenteral

Hastane kaynaklı ve dirençli gram (-) bakterilerin neden olduğu üriner enfeksiyon, alt solunum yolu enfeksiyonları, deri, yumuşak doku ve kemik enfeksiyonları ve diğer ciddi enfeksiyonlarda kullanılırlar.

Sefepim

- Beta-laktamazlara en dayanıklı 4. kuşak sefalosporindir.
- Streptokoklara ve metisiline duyarlı S. aureusa seftazidimden (3. kuşak parenteral sefalosporin) daha etkilidir.
- Plazma proteinlerine az bağlanır (%16-19).
- Tamamen böbrekten atılır.

TÜRKİYE'DE SEFEPİM İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- AVİPİM İM/İV ENJ. TOZ FLAKON 0.5-1 G
- EKİPİM İM/İV ENJ. ÇÖZ. TOZ VE ÇÖZÜCÜ 0.5-1 G
- ROXİPİME İV ENJ. İNF. TOZ FLAKON 2 G
- ROXİPİME İM/İV ENJ. İNF. TOZ FLAKON 1 G
- UNİSEF İM/İV ENJ. TOZ FLAKON 0.5-1 G

5. Kuşak Sefalosporinler

- Yeni sefalosporin türevleridir.
- En önemli özellikleri: Stafilokokların PBP'lerine yüksek afinite gösterirler; **MRSA ve enterokoklara** etkilidirler.

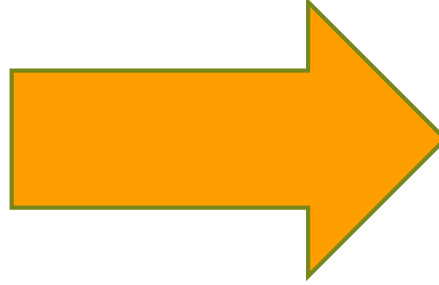
Antibakteriyel
Spektrum

- İlk dört kuşağın etkileyemediği veya dirençli olduğu bakterilere karşı yeni geliştirilen sefalosporinlerin oluşturduğu **5. kuşak** sefalosporinler etkilidir. Bu yeni sefalosporin türevlerini içeren 5. kuşağın en önemli özelliği metisiline dirençli stafilokoklara ve enterokoklara etkili olmalarıdır.

5. Kuşak Sefalosporinler

Parenteral

- Seftarolin fosamil
- Seftobiprol medokaril



TÜRKİYE'DE MÜSTAHZARI BULUNAN 5. KUŞAK SEFALOSPORİNLER

Parenteral

- SEFTAROLİN FOSAMİL

Parenteral

Komplike cilt ve yumuşak doku enfeksiyonları, toplum kaynaklı pnömonide kullanımı vardır.

Seftarolin Fosamil

- İv yoldan uygulanır.
- Pek çok gram (+) ve (-) bakteriler üzerine etkilidir.
- Plazma proteinlerine %20 civarında bağlanır.
- Büyük oranda böbreklerden elimine edilir.

TÜRKİYE'DE SEFTAROLİN FOSAMİL İÇEREN MÜSTAHZARLAR

OMVELİN İNF. ÇÖZ. KONSANTRESİ TOZ 600 MG

KARBAPENEMLER

Karbapenemler

- Yapısı penisilinlere benzeyen beta-laktam antibiyotiklerdir. Diğer beta-laktamlar gibi bakteri hücre duvarında peptidoglikan sentezini inhibe ederek bakterisid etki gösterir.
- **En geniş spektrumlu** beta-laktam antibiyotiklerdir.

Antibakteriyel Spektrum

- ✓ Gram (+) koklar (S. aureus-MRSA hariç, S. epidermidis, E. Faecalis, S. pneumoniae)
- ✓ Gram (+) basiller (L. monocytogenes)
- ✓ Gram (-) çomaklar (Acinobacter, Citrobacter, Salmonella, Klebsiella, Proteus, Enterobacter türleri, E. coli, H. influenzae, P. aurescens)
- ✓ Anaerob bakteriler (Clostridium, Peptococcus, Bacteroides türleri)
- ✓ Actinomyces
- ✓ Nocardia
- ✓ Mikobakteri
- ✓ Klamidya

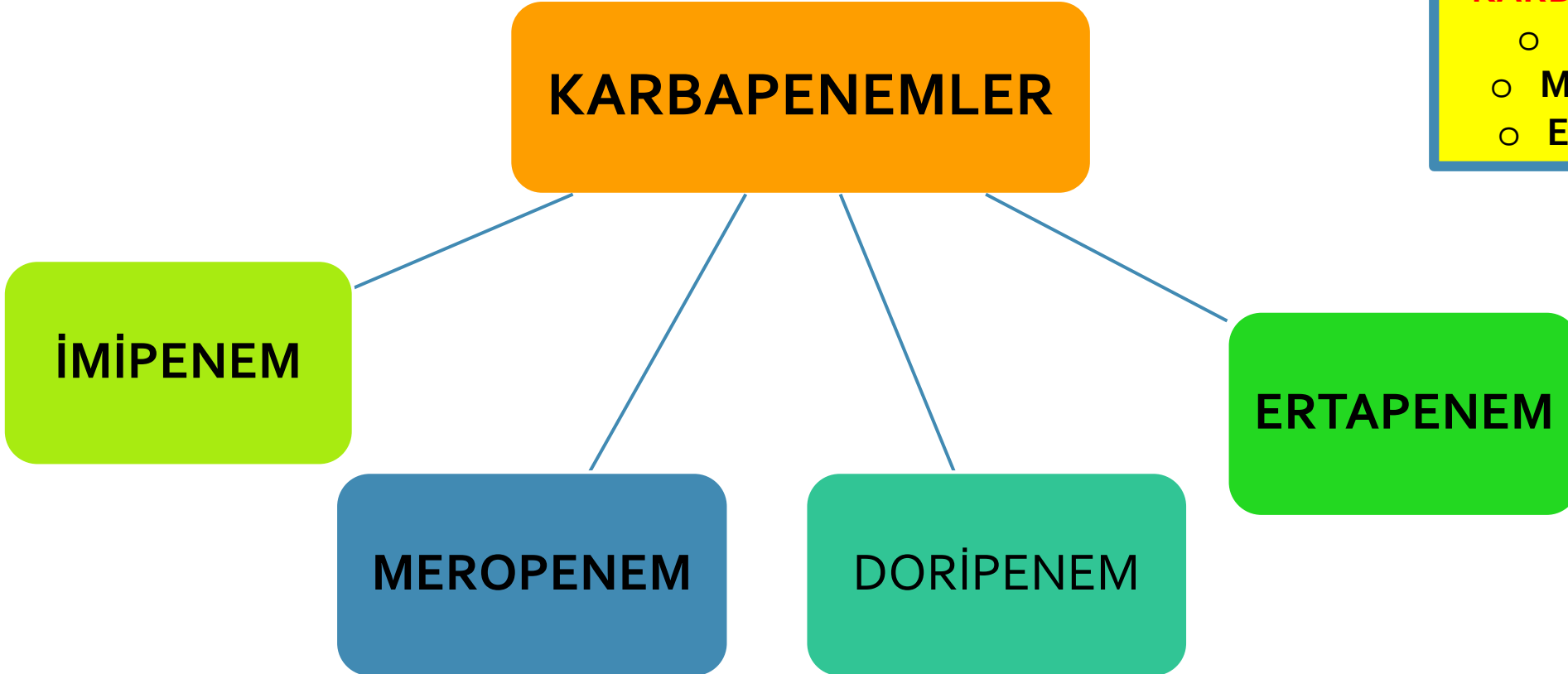
Gram (-) bakteriler tarafından sentezlenen **karbapenemazlar** ile direnç gelişebilir.

Karbapenemler

Yan Etkileri

- GIS yan etkiler oluşabilir: Bulantı, kusma, ağızda tat bozukluğu, diyare, gastroenterit, karın ağrısı.
- Böbrek **fonksiyon bozukluđuna** sebep olabilir.
- Enjeksiyon bölgesinde **lokal reaksiyon** görülebilir.
- Lökopeni, nötropeni, trombositopeni ve hemolitik anemiye neden olabilir.
- Penisilin alerjisi olanlarda **çapraz-alerji oranı düşüktür.**
- **Konvülsiyon** nadiren görülür (İmipinem ve daha nadir ertapenem)

Karbapenemler



TÜRKİYE'DE MÜSTAHZARI OLAN KARBAPENEMLER

- İMİPENEM
- MEROPENEM
- ERTAPENEM

İmipenem

- Klinik kullanıma giren **ilk** karbapenemdir.
- Beta-laktamlara **çok yüksek** derecede dayanıklıdır (kromozom+plazmid aracılı) Penisilinlere ve sefalosporinlere dirençli bakterilerin çoğuna etki eder.
- Beta-laktam antibiyotikler içinde **en geniş spektrumlu** olandır (Meropenemle birlikte).
- En uygun tedavi alanı sefalosporinlere dirençli Enterobacteriaceae kaynaklı idrar yolu enfeksiyonları, intraabdominal ve jinekolojik enfeksiyonlar, kemik, eklem ve cilt enfeksiyonları ve bakteriyel sepsisemilerdir.
- Vücut sıvılarına **iyi** dağılım gösterirler.
- Büyük kısmı **böbreklerden** atılır.

İmipenem

- Mide-bağırsak kanalından absorbe **edilmez**; **iv** yolla uygulanır.
- Böbrek proksimal tubulus hücrelerinde bulunan dipeptidaz türü bir enzim olan **dehidropeptidaz-1 enzimi** tarafından çok hızlı **inaktivasyona** uğrar. Bunun için bu enzimi aktive eden **silastatin** ile kombin edilerek müstahzarlarda bulunur. Silastatinin antibakteriyel etkisi ve beta-laktamazlara etkisi yoktur. İmipenemin etkisini antibakteriyel etkisini değiştirmez.
- **Gastrointestinal** yan etkiler çok sık görülür. Özellikle **hızlı infüzyon** yapıldığında bu yan etkiler daha fazla görülür. Bu nedenle infüzyon hızı ayarlanmalıdır.
- **Konvülsiyon** yapabilir. (Özellikle SSS hastalığı veya böbrek yetmezliği olanlarda)

İmipenem

TÜRKİYE'DE İMİPENEM+SİLASTATİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- CİLAPEM IV İNF. ÇÖZ. TOZ 500 MG/500 MG
- SİLANEM IV İNF. TOZ FLAKON 500 MG/500 MG
- TIENAM İNF. ÇÖZ. TOZ 500 MG/500 MG

-İmipenemin tek başına kullanımı yoktur; sadece silastatin ile kombinasyonu kullanılır.

-Yavaş infüzyon yapılmalıdır.
-Hızlı infüzyon yapılması halinde GIS yan etkilerin görülme sıklığı artar.

Meropenem

- Beta-laktam antibiyotikler içinde **en geniş spektrumlu** olandır (İmipenemle birlikte).
- İmipenem daha çok gram (-) bakterilere etki ederken meropenem daha çok gram (-) bakterilere güçlü etkinlik gösterir. Meropenem özellikle **Pseudomonas aeruginosaya** karşı güçlü etkinlik gösterir.
- Böbrekteki dihidropeptidaz-1 enzimine **dayanıklı** olduğu için imipenemden farklı olarak **tek başına kullanılabilir**.
- Vücut sıvılarına **iyi** dağılım gösterirler.
- Büyük kısmı **böbreklerden** atılır.
- İmipeneme göre **daha az yan etki** görülür. GIS yan etki olarak bulantı görülmediği için **iv bolus** verilebilir. Konvülsiyon yapıcı etkisi düşüktür.

Meropenem

TÜRKİYE'DE MEROPENEM İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- MAXİPEN IV ENJ. VE İNF. TOZ FLAKON 500-1000 MG
- MEROSİD IV ENJ. TOZ FLAKON 500-1000 MG
- MEROZAN ENJ. ÇÖZ. TOZ FLAKON 500-1000 MG
- MOPEM IV ENJ. ÇÖZ. TOZ 500 MG-1 G
- PENEREM IV ENJ./İNF. ÇÖZ. TOZ 500-1000 MG

Ertapenem

- Ertapenemin diğer karbapenemlerden farkı: Pseudomonas ve Acinobactere etkili değildir.
- Diğer karbapenemlere göre avantajı, daha uzun yarılanma ömrü olmasıdır. Bu da **günde tek doz** (parenteral) kullanıma imkan verir.
- İv veya im yoldan uygulanır. İm uygulama sonrası absorpsiyon tama yakındır (%90).
- Büyük kısmı **böbreklerden** atılır.
- Plazma proteinlerine yüksek oranda bağlanır (%95).
- Böbrekteki dihidropeptidaz-1 enzimine **dayanıklısıdır.**
- Toplum kaynaklı pnömoni, komplike üriner enfeksiyon, komplike cilt ve yumuşak doku enfeksiyonları, intraabdominal enfeksiyonların tedavisinde ve kolorektal cerrahi profilaksisinde endikedir.

Ertapenem

TÜRKİYE'DE ERTAPENEM İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- EKİPERTA IM/IV ENJ. LİYOFİLİZE TOZ 1 G
- INVANZ ENJ. LİYOFİLİZE TOZ 1G

MONOBAKTAMLAR

Monobaktamlar

- Tedavide kullanılan **ilk ve tek monobaktam Aztreonam**dir.

MONOBAKTAMLAR

AZTREONAM

Aztreonam

- **Dar** spektrumludur; sadece belirli **gram (-) aerobik bakterilere** etki eder (H. influenzae, Enterobacteriaceae, Neisserialar, Pseudomonas aeruginosa). Gram (+) bakterilere etki etmez.
- Diğer beta-laktamlar gibi hücre duvarı peptidoglikan sentezini inhibe eder.
- **İmmünojenitesi düşüktür**; diğer beta-laktamlarla çapraz-alerji ihtimali azdır. Penisilinlere, sefalosporinlere ve karbapenemlere alerjik olan kişilerde tercih edilebilir.
- Bağırsaktan çok az absorbe edilir. Çoğu **böbreklerden** değişmeden atılır.
- Gram (-) kaynaklı üriner, alt solunum yolu, intraabdominal, kemik ve eklem enfeksiyonlarında kullanılır.
- Enjeksiyon bölgesinde kızarıklık, GIS yan etkiler görülebilir.
- **Şuan ülkemizde müstahzarı yoktur.**

BETA-LAKTAMAZ İNHİBİTÖRLERİ

Beta-laktamaz İnhibitörleri

- Bakterilerin ürettiği beta-laktamaz enzimi ile beta-laktam halkasının hidrolize edilmesi sonucu beta-laktam antibiyotiklerin etkinliği engellenir.
- Beta-laktamaz inhibitörleri yapılarında beta-laktam halkası içerirler, tek başlarına antibakteriyel etkinlik göstermez ve belirgin yan etki oluşturmazlar.
- **Klavulanik asit, Sulbaktam ve Tazobaktam** beta-laktam içeren beta-laktamaz inhibitörleridir.
- **Avibaktam ve Valorbaktam** da beta-laktam halkası içermeyen beta-laktamaz inhibitörleridir.
- Bu inhibitörler beta-laktamazlara duyarlı beta-laktam antibiyotiklerle kombine edilerek kullanılırlar.
- Sulbaktam, penisilin ve sefalosporinlerle kombine edildiğinde antibakteriyel etkinliğin güçlenmesini sağlar; tek başına antibakteriyel etkinliği yoktur.

KAYNAKLAR

- Kayaalp O. *Tıbbi Farmakoloji 2. Cilt*, 13. Baskı, Ankara, Pelikan Yayıncılık, 2012.
- Li Moorman R. In Opioids: Whalen K(ed). *Lippincott Illustrated Reviews: Pharmacology*, 6. ed. Çin, Wolters Kluwer, 2015.