

FLOROKİNOLONLAR

-FARMAKOLOJİ

-ANTİBİYOTİKLER

-FLOROKİNOLONLAR

Florokinolonlar

Etki Mekanizması: Bakterilerde DNA jiraz (DNA çift ipliğinin kesilmesini ve DNA'nın negatif süpersarmal haline gelmesini sağlayan enzim) ve Topoizomeraz IV (Replikasyondan sonra yavru kromozomların ayrılmasını sağlayan enzim) enzimlerini inhibe eder. Böylece DNA replikasyonunu ve transkripsiyonunu bozar ve DNA'yı zedeler.

- Hızlı bakterisid etki gösterirler.
- Geniş spektrumlu antibiyotiklerdir.
- Kimyaca suda çözünürler ve fazla lipofilik bileşiklerdir.
- İnsan hücreleri içine kolay girerler. Bu nedenle intraselüler yerleşim gösteren duyarlı patojen bakterilere etki ederler.

Florokinolonlar

Antimikrobik Spektrum

- Gram (-) basiller (Enterobacteriaceae türleri, H. influenzae, Pseudomonas aeruginosa, Acinobacter, Legionella pneumophila, Campylobacter türleri)
- Penisiline dirençli Neisseria gonorrhoeae-meningitidis, Vibrio cholerae
- Chlamydia trachomatic, Mycoplasma pneumoniae
- Mycobacterium tuberculosis
- Chlamydia, Legionella, Moraxella

Florokinolonlar

Rezistans

1. Esas olarak topoizomerazlarda kromozomal mutasyonla oluşur. Mutasyon sonucu hedef bölgenin yapısı değişebilir.
 2. Membran geçirgenliğinin azalması veya efflux sistemi ile dışarı pompalanma sonucu hücre içi konsantrasyon azalır.
 3. Asitellenme sonucu inaktive edilebilirler.
- Kullanma sıklığı ile orantılı olarak bütün florokinolonlara rezistans gelişebilir ancak yine de toplam rezistans sıklığı düşük bir antibiyotiktir.
 - Stafilokokların çoğu florokinolonlara karşı rezistandırlar.
 - İdrarda genelde yüksek konsantrasyonda bulunurlar; idrar yolu enfeksiyonlarında nadiren rezistans gelişir.

Florokinolonlar

Farmakokinetik

- **Lipofilik** bileşiklerdir.
- Mide-bağırsak kanalından iyi absorbe edilirler.
- Vücutta **yaygın dağılım** gösterir; dokulara iyi sokulurlar. Böbrek, akciğer, bronş, çizgili kas, safra kesesi, prostat, idrar içindeki konsantrasyonları genelde plazmadan daha yüksektir.
- Gram (-) bakterilere karşı **postantibiyotik** etkileri vardır ve aminoglikozitler gibi uzundur.
- Karaciğerde CYP enzimleri tarafından metabolize edilirler.
- Plazma proteinlerine az bağlanmalarına karşın dağılım hacimlerinin yüksek oluşu ve dokulara fazlaca sokulmaları nedeniyle **eliminasyon yarılanma ömürleri uzundur.**

Florokinolonlar

Yan Etkileri

- En yaygın olarak **GIS tahriş** yaparlar, buna baęlı olarak bulantı, kusma, diyare, iřtahsızlık ve karın aęrısı gibi yan etkilere sebep olabilirler.
- Aęızda metalik tat oluřturabilirler.
- **Güneře hassasiyet** oluřturabilirler, bu nedenle florokinolon kullanan hastalar bu konuda bilgilendirilmelidir; hastaya ilacı kullandıęı süre boyunca doęrudan güneř iřıęına maruz kalmaması ve güneř koruyucu kullanması önerilebilir.
- Bař aęrısı, bař dönmesi, huzursuzluk, uykusuzluk ve konfüzyon yapabilirler.

Florokinolonlar

Yan Etkileri

- Kemik ve tendonlarda erozyona sebep olabilir. İnsanlarda nadir olarak tendinit, tendon yırtılması bildirilmiştir. Bu durumun olma ihtimali; **öyküsü olanlarda, yaşlı hastalarda, kortikosteroid kullananlarda** daha fazladır.

Gelişmekte olan kemik ve tendonlarda oluşturacağı bu potansiyel risk nedeniyle **bebeklerde, gelişme çağındaki çocuklarda, gebelerde ve emziren kadınlarda kullanılmamalıdır.**

Florokinolonlar

Yan Etkileri

- **QT aralığını uzatma** potansiyeli vardır, bu nedenle QT aralığını uzatan ilaçlarla birlikte kullanımından kaçınılmalıdır.
- Yüksek dozda öyküsü olan kişilerde **konvülsiyon** yapabilir. Antiinflamatuvar ilaçlarla birlikte kullanımında bu etki artar.
- Ciltte döküntü ve vajinada Candida enfeksiyonuna sebep olabilirler.

Florokinolonlar

Magnezyum ve alüminyumlu antiasitler, sükralfat, kalsiyum, magnezyum, çinko, demir bileşikleriyle etkileşir. Şelat oluştururlar ve biyoyararlanım azalır. Birlikte kullanılmaları halinde arada en az 2 saat olmalıdır.

Teofilin ve florokinolonların prokonvülsif etkileri olduğu için farmakodinamik etkileşime girerler.

ETKİLEŞİMLERİ

Teofilin ve kafeinin yıkımını yavaşlatır ve toksisitelerini artırır.

Antikoagülanların yıkımını yavaşlatarak etkinliğini artırabilirler.

Florokinolonlar

Florokinolon Türleri

- Siprofloksasin
- Norfloksasin
- Ofloksasin
- Levofloksasin
- Enoksasin
- Lomefloksasin
- Perfloksasin
- Moksifloksasin
- Gatifloksasin

Türkiye'de Müstahzarı Bulunan Florokinolonlar

- ❖ Siprofloksasin
- ❖ Ofloksasin
- ❖ Levofloksasin
- ❖ Moksifloksasin
- ❖ Lomefloksasin

Siprofloksasin

- Fazla patojene etkili olması ve en fazla denenmiş florokinolon olması sebebiyle sistemik enfeksiyonların tedavisinde en sık kullanılan florokinolondur.
- **Gravimetrik etki gücü en yüksek** olan florokinolondur.
- En hızlı absorbe edilen florokinolonlardandır; %60-80 oranında absorbe edilir. Besinlerle birlikte alınmaları **absorpsiyon hızını azaltır**; miktarını deęiřtirmez.
- Magnezyum ve alüminyumlu antiasitler, sükralfat, kalsiyum, magnezyum, çinko, demir bileřikleri ile birlikte kullanılması halinde **arada 4 saat olmalıdır**.
- **Parenteral** olarak kullanılan 3 florokinolondan biridir. (Diđerleri ofloksasin ve levofloksasin)
- Karaciđer ve safrada oldukça yüksek konsantrasyon oluřturur.

Siprofloksasin

ENDİKASYONLARI

- Shigella, Salmonella ve Campylobacter jejuni enteriti, Pseudomonas aeruginosa, E. coli kaynaklı idrar yolu enfeksiyonlarında en tercih edilen ilaçlardandır.
- Akut idrar yolu enfeksiyonlarında, prostatitte, gonokokal üretrit, şankroidde kullanımı vardır.
- Kronik osteomyelitte kullanılır.
- Diyabetik ayak enfeksiyonunda tedavi sağlar.
- Üst ve alt solunum yolu enfeksiyonlarında, gıç kanal enfeksiyonlarında kullanılır.
- Antraks (şarbon) tedavisinde kullanımı vardır.
- Göz enfeksiyonlarında lokal tedavi olarak kullanılır.

Siprofloksasin

TÜRKİYE'DE SİPROFLOKSASİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- BAYSİP FİLM KAPLI TABLET 500 MG
- CİFLOSİN FİLM KAPLI TABLET 500-750 MG
- CİPRASİD FİLM TABLET 500-750 MG
- CİPRO FİLM TABLET 250-500-750 MG
- CİPROKTAN FİLM TABLET 500 MG
- CİPRONATİN FİLM TABLET 500-750 MG
- LOXASİD FİLM TABLET 500 MG
- PROXACİN FİLM TABLET 500-750 MG
- ROFLAZİN FİLM KAPLI TABLET 500-750 MG
- ROXİN FİLM KAPLI TABLET 500-750 MG
- SANSET FİLM TABLET 500-750 MG
- SİFLOKS FİLM KAPLI TABLET 500-750 MG
- SİPLONE FİLM TABLET 500 MG
- SİPROSAN FİLM KAPLI TABLET 500 MG
- CILOXAN OFTALMİK MERHEM %0.3
- CILOXAN STERİL GÖZ DAMLASI ÇÖZ. %0.3
- CİPRO GÖZ DAMLASI %0.3
- FLOXİMED GÖZ DAMLASI %0.3
- SİPROGUT STERİL GÖZ DAMLASI ÇÖZ. %0.3

Siprofloksasin

TÜRKİYE'DE SİPROFLOKSASİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- CIPROKABI İNF. ÇÖZ. 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- CİFLOSİN İV İNF. ÇÖZ. 200 MG/100 ML
- CİPRO İV İNF. İÇİN ÇÖZ. FLAKON 200 MG/100 ML
- CİPROCAM İV İNF. İÇİN ÇÖZ. FLAKON 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- CİPROKTAN İV İNF. İÇİN ÇÖZ. 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- CİPRONATİN İV İNF. ÇÖZ. FLAKON 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- CİPROPOL İV İNF. İÇİN ÇÖZ. 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- FLOTİC İV İNF. ÇÖZ. FLAKON 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- NOVAREX İV İNF. ÇÖZ. 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- ROFACİD İV İNF. ÇÖZ. 200 MG/100 ML
- SELFLEKS CİPRASEL İV İNF. ÇÖZ. 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- SİPROJECT İV İNF. ÇÖZ. 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- SLOXACİN İV İNF. ÇÖZ. 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- UFEXİL İV İNF. İÇİN ÇÖZ. 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- VONECİP İV İNF. ÇÖZ. 200 MG/100 ML-400 MG/200 ML
- SİPROGUT PLUS KULAK DAMLASI ÇÖZ.

Ofloksasin

- En hızlı absorbe edilen florokinolonlardandır ve **tama yakın derecede** absorbe edilir. Besinlerle birlikte alınması absorpsiyon hızını azaltır; oranını deęiřtirmez.
- **Parenteral** yolla kullanılan 3 florokinolondan biridir.
- Karacięerde fazla deęiřime uğramaksızın böbreklerden elimine edilir. Vücutta **en az elimine edilen** florokinolonlardandır.
- İdrardaki konsantrasyonu plazmadakinin **300-400** katı kadardır; bu nedenle idrar yolu enfeksiyonlarında tercih edilir.

Ofloksasin

ENDİKASYONLARI

- Shigella, Salmonella ve Campylobacter jejuni enteriti, Pseudomonas aeruginosa, E. coli kaynaklı idrar yolu enfeksiyonlarında en tercih edilen ilaçlardandır.
- İdrar yolu enfeksiyonların; gonore, gonore dışı üretrit, servistte kullanımı vardır.
- Komplikasyonsuz genital klamidya enfeksiyonunda kullanımı vardır.
- Tifo tedavisinde kullanımı vardır.
- Üst ve alt solunum yolu enfeksiyonlarında, gıç kanal enfeksiyonlarında kullanılır.
- Kronik bronşit akut alevlenmelerinde kullanılır.
- Göz enfeksiyonlarında lokal tedavi olarak kullanılır.

Ofloksasin

TÜRKİYE'DE OFLOKSASİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- MENEFLOKS FİLM KAPLI TABLET 200-400 MG
- OFKOZİN FİLM TABLET 200 MG
- TARİVİD FİLM TABLET 200-400 MG
- ROFLOXAN IV İNF. İÇİN ÇÖZ. FLAKON 200 MG/100 ML
- EXOCIN GÖZ DAMLASI %0.3
- ZARİDİNEX STERİL GÖZ DAMLASI %0.3

Levofloksasin

- Ofloksasinin izomeridir; antimikrobik gücü ofloksasinin 2 katıdır.
- Büyük ölçüde böbreklerden deęişmeden atılır ve idrarda konsantredir.
- **Parenteral** yolla kullanılan 3 florokinolondan biridir.
- Vücutta en az metabolize edilen florokinolonlardandır.
- Strep. pneumoniae ve dięer gram (+) kokuslara karşı etkinlięi yüksektir.

Levofloksasin

ENDİKASYONLARI

- Shigella, Salmonella ve Campylobacter jejuni enteriti, Pseudomonas aeruginosa, E. coli kaynaklı idrar yolu enfeksiyonlarında en tercih edilen ilaçlardandır.
- İdrar yolu enfeksiyonların; gonore, gonore dışı üretrit, servisitte kullanımı vardır.
- Komplikasyonsuz genital klamidya enfeksiyonunda kullanımı vardır.
- Tifo tedavisinde kullanımı vardır.
- Üst ve alt solunum yolu enfeksiyonlarında, gıç kanal enfeksiyonlarında kullanılır.
- Kronik bronşit akut alevlenmelerinde kullanılır.
- Göz enfeksiyonlarında lokal tedavi olarak kullanılır.

Levofloksasin

TÜRKİYE'DE LEVOFLOKSASİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- BERAXİN FİLM TABLET 500-750 MG
- CRAVİT FİLM TABLET 500-750 MG
- FLOXİLEVO FİLM TABLET 500-750 MG
- İNFECUR FİLM TABLET 500-750 MG
- LABEL FİLM TABLET 750 MG
- LEFOX FİLM TABLET 500-750 MG
- LEVONAT FİLM TABLET 500-750 MG
- LEVONİDİN FİLM TABLET 500-750 MG
- LEVOWORLD FİLM TABLET 500 MG
- LEVOXİMED FİLM KAPLI ATBLET 250 MG
- LEVOZER FİLM KAPLI TABLET 500 MG
- LEXUR FİLM TABLET 500 MG
- NEVOTEK FİLM TABLET 500-750 MG
- POTANT FİLM TABLET 500 MG
- TAVANİC FİLM TABLET 500 MG
- VOLEFLOK FİLM TABLET 500-750 MG
- LEVOLON GÖZ VE KULAK DAMLASI ÇÖZ. %0.5
- LEVOXİMED GÖZ VE KULAK DAMLASI ÇÖZ. %0.5

Levofloksasin

TÜRKİYE'DE LEVOFLOKSASİN İÇEREN MÜSTAHZARLAR

- ACOMET İV İNF. ÇÖZ. 500 MG/100 ML
- FLOXİLEVO İV İNF. ÇÖZ. 500 MG/100 ML
- LEBEL İV İNF. İÇİN ÇÖZ FLAKON 500 MG/100 ML
- LEFOX İV İNF. İÇİN ÇÖZ FLAKON 500 MG/100 ML
- LEVOJECT İV İNF. İÇİN ÇÖZ FLAKON 500 MG/100 ML
- LEVOXİMED İV İNF. İÇİN ÇÖZ FLAKON 500 MG/100 ML
- LEVOXİPOLİN İV İNF. İÇİN ÇÖZ FLAKON 500 MG/100 ML
- LEXSAN İV İNF. İÇİN ÇÖZ FLAKON 500 MG/100 ML
- LİEVO İV PERFÜZYON ÇÖZ. FLAKON 500 MG/100 ML
- MULTİFLEX LEVOFLEX İV İNF. İÇİN ÇÖZ FLAKON 500 MG/100 ML
- RAVİVO İV İNF. İÇİN ÇÖZ FLAKON 500 MG/100 ML
- TAVANİC İV İNF. İÇİN ÇÖZ FLAKON 500 MG/100 ML
- VOLEFLOK İV İNF. İÇİN ÇÖZ FLAKON 500 MG/100 ML-750 MG/150 ML
- **TRİLEVO TEDAVİ PAKETİ** (Amoksisilin-Lansoprazol-Levofloksasin)

Amoksisilin-Ppi-Klaritromisin üçlü tedavisine yanıt vermeyen Helicobacter pyloride endikedir. nu

Moksifloksasin

- Gram (+) kokuslara ve anaerobik bakterilere diđer florokinolonlardan daha etkilidir.
- EKG'de QT aralıđını uzatır.
- Hepatotoksik etki yapabilir. Bu nedenle karaciđer problemi öyküsü olan veya hepatotoksik etkisi olan başka ilaç kullanan hastalarda dikkatli olunmalıdır.

Moksifloksasin

ENDİKASYONLARI

Üst solunum yolu enfeksiyonlarında ve toplum kaynaklı pnömonide kullanımı vardır.

Kronik bronşitin akut alevlenmelerinde kullanılır.

Komplikasyonlu cilt ve yumuşak doku enfeksiyonlarında kullanılır.

Komplike intraabdominal enfeksiyonlarda kullanımı vardır.

Moksifloksasin

ENDİKASYONLARI

- ATAFLOKS FİLM KAPLI TABLET 400 MG
- AVELOX FİLM KAPLI TABLET 400 MG
- DEMOXİF FİLM TABLET 400 MG
- MOFELOX FİLM TABLET 400 MG
- MOKSEFEN FİLM TABLET 400 MG
- MOXACİN FİLM TABLET 400 MG
- MOXAİ FİLM KAPLI TABLET 400 MG
- MOXDAY FİLM TABLET 400 MG
- MOXİCUM FİLM TABLET 400 MG
- MOXİFOR FİLM TABLET 400 MG
- MOXİTAB FİLM KAPLI TABLET 400 MG
- MOXİTEC FİLM TABLET 400 MG
- PİTOXİL FİLM TABLET 400 MG

Moksifloksasin

ENDİKASYONLARI

- AVELOX İV İNF. SOL. 400 MG/250 ML
- MOFELOX İV İNF. ÇÖZ. 400 MG/250 ML
- MOKSEFEN İV İNF. ÇÖZ. FLAKON 400 MG/250 ML
- MOKSİLOX İV İNF. ÇÖZ. 400 MG/250 ML
- MOXACİN İV İNF. ÇÖZ. FLAKON 400 MG/250 ML
- MOXHEL İV İNF. ÇÖZ. FLAKON 400 MG/250 ML
- MOXİCUM İV İNF. ÇÖZ. FLAKON 400 MG/250 ML
- MOXİFİX İV İNF. ÇÖZ. FLAKON 400 MG/250 ML
- MULTİFLEX MOXİFİX İV İNF. ÇÖZ. 400 MG/250 ML
- PNEMOX İV İNF. ÇÖZ. 400 MG/250 ML
- TÜRKİPSAN MOKSİFLOKSASİN İV İNF. ÇÖZ 400 MG/250 ML
- BİVOXA OFTALMİK ÇÖZ. %0.5
- DEMOXİF GÖZ DAMLASI ÇÖZ. %0.5
- MOVAFLOX GÖZ DAMLASI %0.5
- MOXAİ GÖZ DAMLASI ÇÖZ. %0.5
- VİGAMOX STERİL OFTALMİK ÇÖZ. %0.5
- MOXİDEXA GÖZ DAMLASI ÇÖZ. 5 MG/1 ML

Lomefloksasin

- İdrar yolu enfeksiyonlarının ve alt solunum yolu enfeksiyonlarının tedavisinde kullanılır.
- Türkiye'de göze lokal olarak uygulanmak amacıyla kullanılan oftalmik bir preparatı bulunmaktadır.

TÜRKİYE'DE LOMEFLOKSASİN İÇEREN MÜSTAHZAR

- OKACİN GÖZ DAMLASI 3 MG/ML

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.