

# **Makrolit Antibiyotikler**

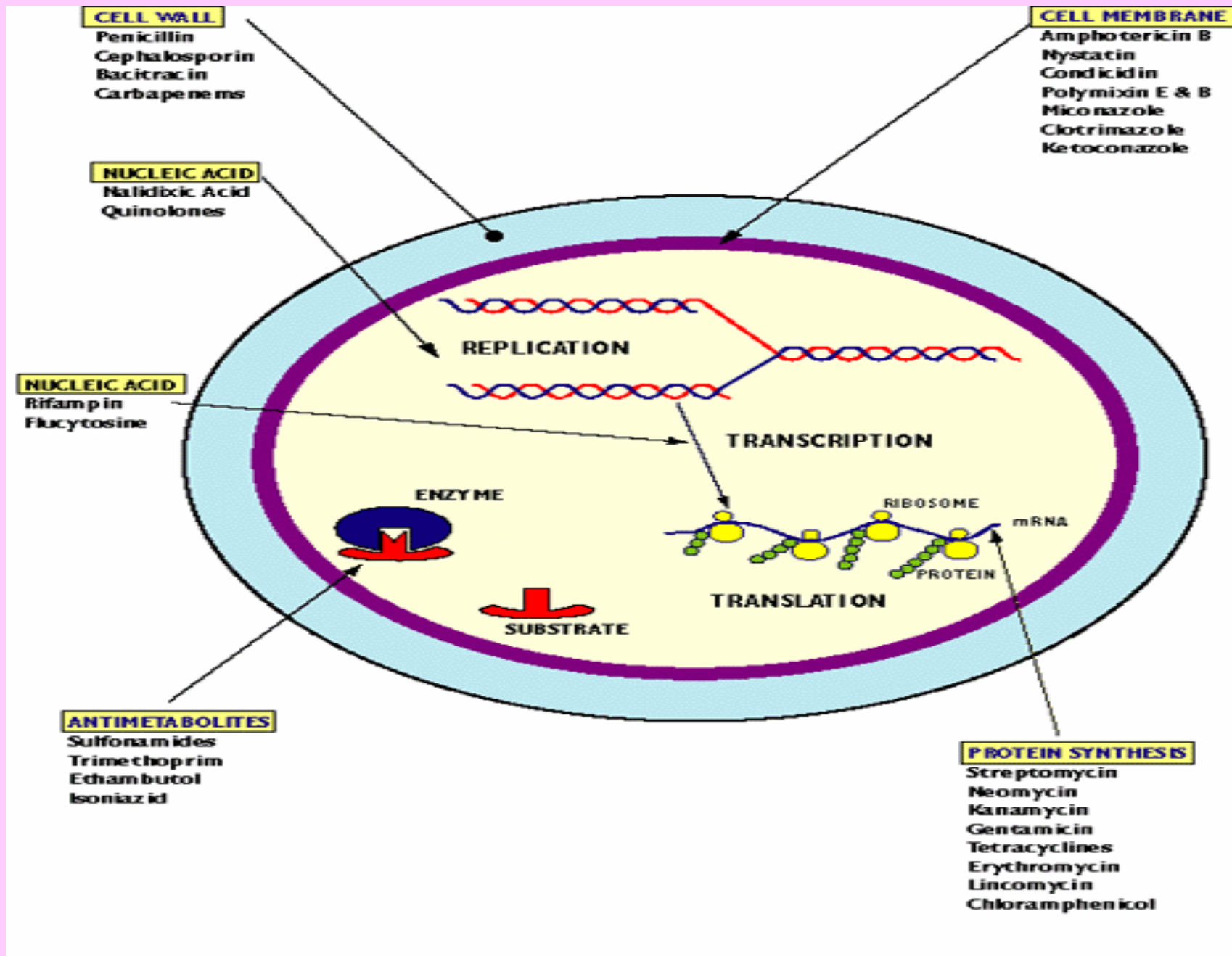
# Makrolitler

- Eritromisin
- Klaritromisin
- Azitromisin
- Spiramisin
- Rokitamisin
- Fluritromisin
- Kitasamisin
- Troleandomisin
- Rozaromisin
- Jozamisin
- Roksitromisin
- Diritromisin
- Karbomisin
- Miokamisin

# Etki mekanizmaları

Bakteri ribozomlarının 50S- alt birimindeki **23S'e** bağlanarak, aynı yere tRNA'nın bağlanmasını ve dolayısıyla **peptid yan zincirin uzamasını** önlerler.

- **Bakteriyostatik** etkilidirler,
- **İntraselüler** mikroorganizmalara da etkilidirler,
- Aynı noktaya bağlanan **kloramfenikol ve linkozamidlerle** birbirlerinin etkilerini **antagonize** ettiklerinden **kombine kullanılamazlar**.



# Direnç gelişimi

Bakterilerin **metilaz** enzimi salgılamasıyla olur. Metilaz, tRNA'daki antibiyotik bağlanma yerlerini metiller.

# Eritromisin- 1

Antibakteriyel spektrumu **pen G'ye benzer**, beta-laktamaz üreten Staf. aureus'un suşlarının çoğuna, gram (+) ve gram (-) koklara ve gram (+) basillere etkilidir.

Beta- hemolitik streptokok ve Strep. Pnömonia hariç (bunlara **bakterisid**), **bakteriyostatik** etkilidirler.

Streptokok infeksiyonlarında penisilinlerin alternatifidir.

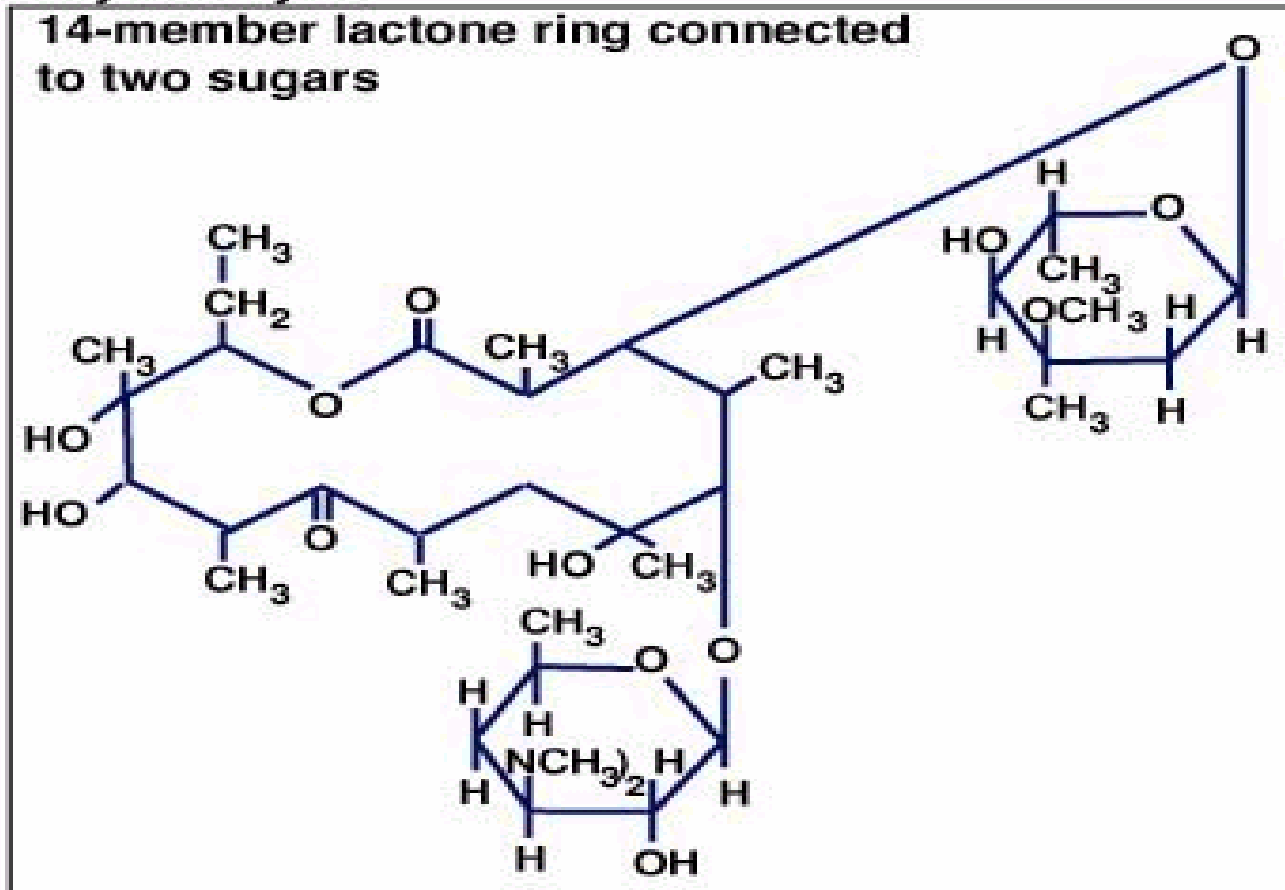
**Anaeroblara etkisizdirler.**

BOS hariç diğer sıvılara geçişi iyidir. Prostat sıvısına geçen nadir antibiyotiklerdendir.

# Erythromycin: a Macrolide Antibiotic

## Erythromycin

14-member lactone ring connected to two sugars



# Eritromisin- 2

Şu enfeksiyonlarda **ilk tercih edilen** ilaçtır :

- Lejyoner hastalığı
- Mycoplasma pnömosisi (**NOT : Ayrıca, tetrasiklinler ve kloramfenikolde kullanılabilir**),
- Boğmaca
- Bebeklerin klamidial pnömonisi
- Gebelikte klamidial pelvik infeksiyonlar
- **Difteri ve difteri portörlüğü** (penisilin ile birlikte)
- Hemofilus ducrei
- Campylobacter jejuni enteriti

## Eritromisin- 3

Baz eritromisin aside dayanıksız olduğundan oral kullanıma özgü **etosüksinat** ve **estolat** esterleri kullanılır. **Gluseptat** ve **laktobiyonat** esterleri i.v. kullanılır. Makrofajlarda ve karaciğerde birikir. Karaciğerde metabolize olur. KC fonksiyon bozukluğunda **kontrendikedir**. Büyük oranda **safra ile atılır**.

Eritromisin, bir barsak hormonu olan **motilin**'in etkisini taklit ederek mide boşalmasını hızlandırır. Bazı KC enzimlerini inhibe eder. Böbrek yetmezliğinde doz ayarlanmasına gerek yoktur.

# Klaritromisin

Spektrumu eritromisine benzer, ancak staf. ve streptokoklara daha etkilidir. Ayrıca H. Influenza, **Helikobakter pylori**, mikobakterium avium / intraselülar, lepramatöz lepra (yardımcı ilaç), Toxoplasma gondii (+pirimetamin ile) infeksiyonlarında kullanılır.

# Azitromisin

**En uzun etkili makrolittir** (24- 72 saat).

Eritromisin endikasyonlarının dışında AIDS'de mikobakterium avium /intraselülarde, H. Influenza, moraxella catarrhalis, trahom, gonore ve toxoplasmada kullanılır.

Mikrozomal enzimleri etkilemez.

# Spiramisin

Toksoplazmada oldukça etkilidir. Özellikle **gebelerde tercih** edilir.

Göz iltihaplarında lokal kullanılır, göze iyi geçer.

# Makrolitlerin yan etkileri

- Eritromisinin en önemli yan etkisi **KOLESTATİK HEPATİT**'dir. Özellikle **estolat** türevinde oluşur.
- GİS'de **Motilin** reseptörlerini aktive ederek mide boşalmasını hızlandırdıklarından **diyabetik gastropatide** yararlıdırlar.
- Klaritromisin ve azitromisin doza bağımlı **işitme kaybı** oluşturabilirler.
- Eritromisin, teofilin, varfarin gibi bazı ilaçların KC'deki metabolizmalarını yavaşlatarak kan düzeylerinin toksik düzeylere çıkmasına neden olabilir.