



Aspirin'in Farmakolojik Özellikleri Dün, Bugün ve Gelecek...

Prof. Dr. Öner Süzer
Cerrahpaşa Tıp Fakültesi
Farmakoloji ve Klinik Farmakoloji Anabilim Dalı

www.onersuzer.com
osuzer@istanbul.edu.tr

Aspirinin bulunuşu

- Söğüt ağacı kabuklarından elde edilen ekstrenin ağrı kesici etkisi binlerce yıldır bilinmektedir. Bu etkiyi oluşturan maddenin salisilik asit olduğu bulunmuştur.
- 1897 yılında bir Bayer kimyacı olan Felix Hoffmann salisilik asit üzerine yaptığı çalışmalarla saf olarak asetilsalisilik asidi elde etmeyi ve bileşimin açık kimyasal yapısını ortaya çıkartmayı başarmıştır.
- Yapılan çalışmalar saf asetilsalisilik asidin salisilattan daha iyi tolere edildiğini ortaya çıkartınca 1899 yılında ilaç olarak piyasaya sürülmüştür.

Aspirin'in araştırıldığı yayınlar

- Medline taramasında Aspirin, *acetylsalicylic acid* veya ASA anahtar kelimeleriyle tarama yapıldığında 49945 yayına rastlanmaktadır.
- Aspirin'den sonra en çok araştırılan parasetamolle 13197, ibuprofenle 6766 yayın mevcuttur.
- Son bir yıl içinde yapılan yayınlar Aspirin, parasetamol ve ibuprofen için sırasıyla 2382, 732 ve 400'dir.

3

Kendi kitabımda Aspirin'den bahsedilen sayfalar

Aspirin, 6, 12, 13, 18, 19, 20, 21,
24, 28, 30, 31, 33, 40, 43, 106,
141, 161, 165, 245, 250, 253, **255-**
259, 262, 264, 444, 446, 451, 459,
460, 463, 464, 470, 527, 528,

aspirin direnci, 459

Aspirin Forte, 551

Aspirin Plus C, 551

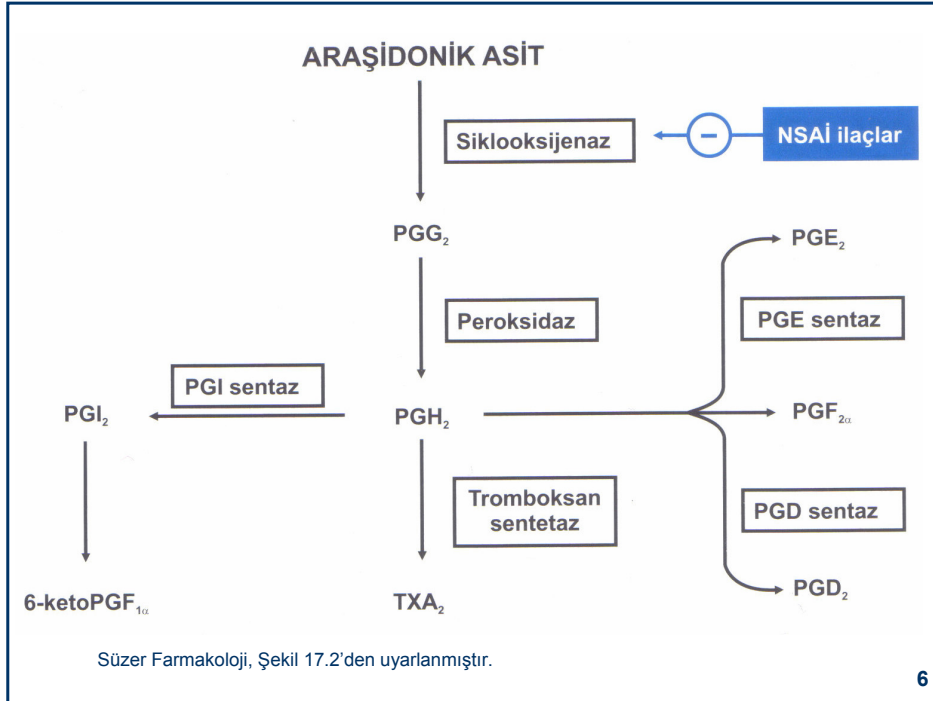
Kaynak: Süzer Farmakoloji, İndeks

4

Etki mekanizmasının bulunuşu

- Aspirinin prostaglandinlerin yapımını engellediđi 1971 yılında İngiliz Farmakolog Prof. John Vane tarafından bulunmuştur.
- Prof. John Vane bu ıđır aan buluşuyla 1982 yılında Nobel Tıp dölü'ne layık görölmüştür.

5



Prostaglandinlerin etkileri

- Düz kaslar üzerine (damarlar, gastrointestinal sistem, solunum yolları...)
- Ağrı oluşumu üzerine
- İnflamatuar
- Piretik
- Abortus yapıcı
- Mide mukozasını koruyucu
- Böbrekler üzerine
- Trombosit agregasyonu üzerine

7

Siklooksijenaz enzimi (COX)

- Nonsteroid antiinflatuar (NSAI) ilaçların hepsi siklooksijenaz enzimi inhibitörleridir.
- Araşidonik asitten prostaglandinlerin yapımını sağlayan iki ayrı tip siklooksijenaz enzimi vardır: COX₁ ve COX₂.

8

NSAİ ilaçları, COX₁ ve COX₂ enzimlerine rölatif seçiciliklerine göre sınıflandırma

- **COX₁ seçiciler:** Aspirin, indometasin, sulindak, piroksikam ve tolmetin.
- **Her iki enzimi yaklaşık olarak aynı derecede inhibe edenler:** Naproksen, ibuprofen, flurbiprofen, diklofenak, nabumeton.
- **COX₂ seçiciler:** Etodolak, meloksikam, nimesulid, rofekoksib, selekoksib

9

Aspirinin özellikleri

- Aspirin siklooksijenaz enzimini geri dönüşümsüz olarak bloke eden tek NSAİ ilaçtır. Bu etkisi miyokard enfarktüsü ve inmeleri önleyici etkisinin temelini oluşturmaktadır.
- Siklooksijenaz enzimin tiplerini inhibe edici etkileri farklı olduğu için farklı dozlarda farklı etkiler elde edilebilmektedir.

10

Aspirinin gnlk dozları

- 75-300 mg'lık dozlar antiagregan (kanı sulandırıcı),
- 1-2 g'lık dozlar ağrı kesici,
- 2-4 g'lık dozlar antiinflamatuvar amaçlı kullanılır.

11

Aspirinin önemli kullanımları

- Ağrı kesici
- Ateş düşürücü
- Antiromatizmal, antiinflamatuvar
- Miyokard enfarktüsü ve inmeleri önleme...

12

Aspirinin ve NSAİ ilaçların yan etkileri

- **Gastrointestinal sisteme ait yan etkiler:** Dispepsi (gastrit, duodenal ülserler), bulantı, kusma, gastrointestinal sistem kanaması
- **Böbreklere ait yan etkiler:** Su ve tuz retansiyonu, ödem, geri dönüşümlü böbrek yetmezliği.
- **Diğer yan etkiler:** Cilt reaksiyonları, bronkospazm; nadiren karaciğer hastalığı, kemik iliği depresyonu.
- **Ayrıca:** Viral enfeksiyon geçiren çocuklarda ensefalit (Reye sendromu).

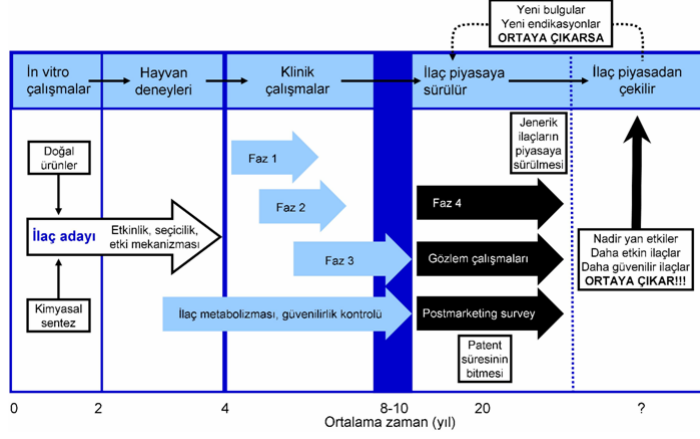
13

Aspirin kullanmaması gerekenler

- Aspirine veya diğer NSAİ ilaçlara alerji
- Gastrointestinal sistem kanaması hikayesi, gastrit veya peptik ülser
- Kanama bozuklukları
- Astım
- Kontrol edil(e)meyen hipertansiyon
- Şiddetli karaciğer veya böbrek yetmezliği
- Gebeliğin son üç ayı
- Viral enfeksiyon geçiren çocuklar

14

Yeni bir ilacın piyasaya çıkma sürecinde geçirdiği aşamalar



15

Son söz

- Yeni bir ilaç piyasaya çıkınca yaklaşık beşbin kişide denenmiş olur.
- Kendi tahminim bu güne kadar Aspirin'i kullanan insan sayısı beşmilyarın üzerindedir...

16

Teşekkürler