

# PENİSİLİNLER

---

# Penisilinler

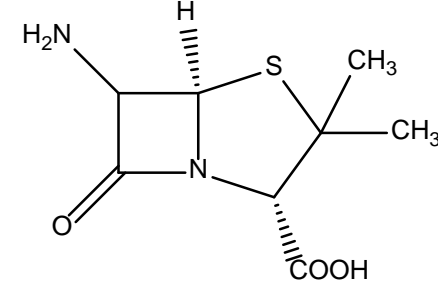
- **İlk** bulunan antibiyotiktir. Yeni türevlerinin de bulunmasıyla en hızlı gelişim gösteren antibiyotik grubudur.
- **Güçlü bakterisid** etkili, alerjik olmayanlarda **düşük toksiteli** ve **ucuz** ilaçlardır. Bu nedenle çeşitli enfeksiyonlarda en tercih edilen ilaçlardandır.
- Klinik kullanıma giren 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-laktamlara 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.
- **Penisiloid 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, dudanın, 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 sıktır.
- 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)
- Asilüroidopenisilinler (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

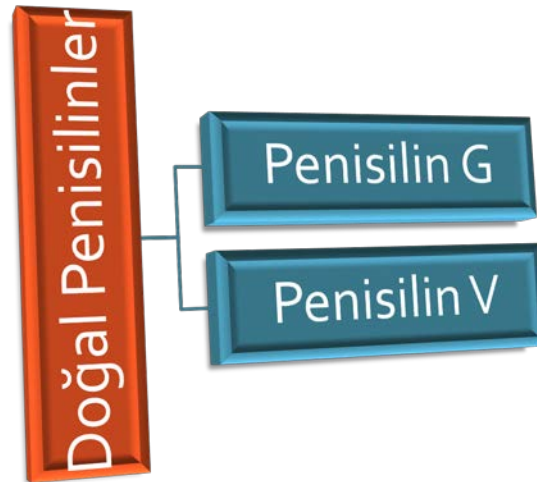
### ANTİPSÖDOMONAL PENİSİLİNLER

-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 çözüdüğü 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)

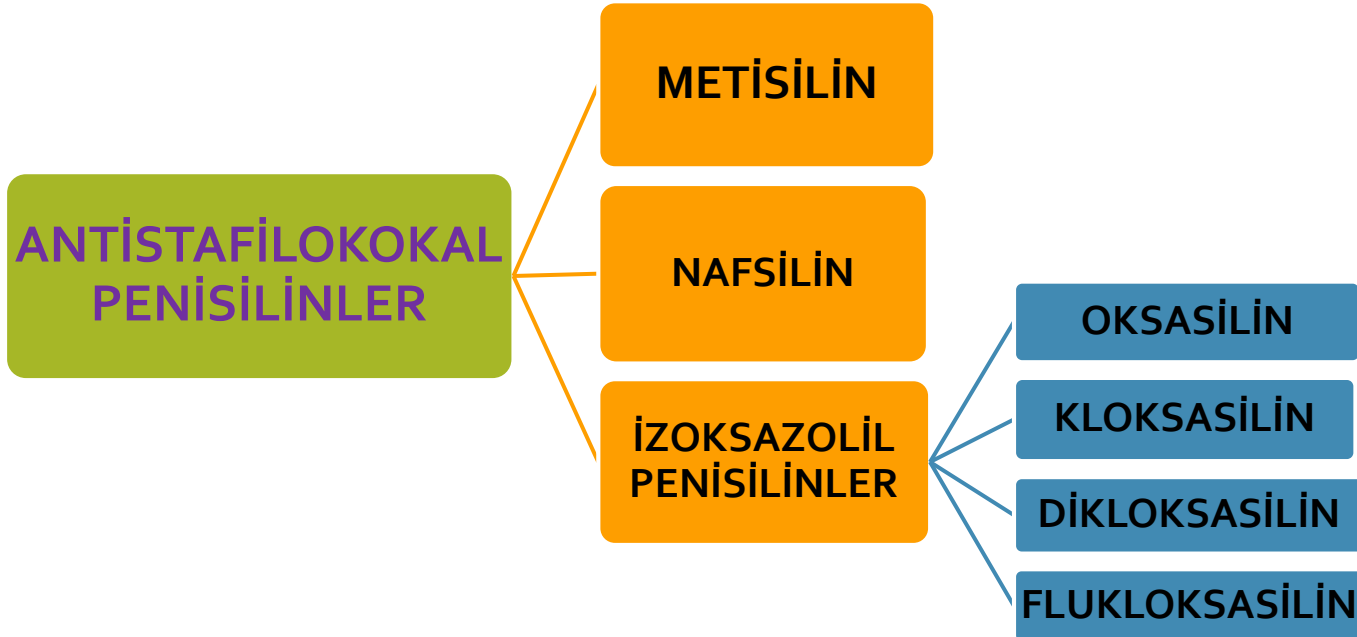
## TÜRKİYE'DE BULUNAN PENİSİLİN V MÜSTAHZARLARI

- ✓ 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

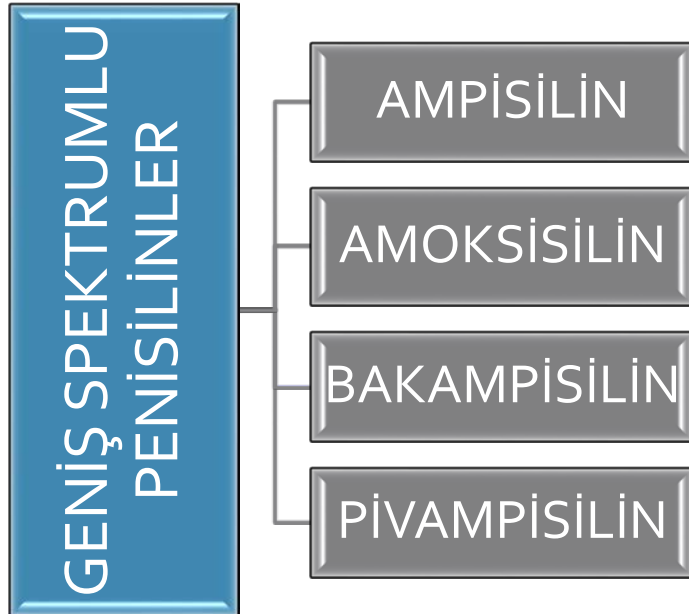
- Oral kullanımda biyoyararlanımı yüksektir fakat besinler absorpsiyonu azaltır bu nedenle **AÇ** karnına kullanılmalıdır.
- Büyük oranda böbreklerden **yavaş** elimine edilir. Eliminasyonu yavaş; etki süresi uzundur.
- Plazma proteinlerine %90 civarında bağlanır.

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, ampisilininkinden yaklaşık iki katıdır ve daha uzun sürelidir.
  - ❖ Safra içindeki konsantrasyonu ampisilinkinden fazladır.
- ❖ İnterstisyel sıvıya, orta kulak sıvısına, burun sinüs salgısına, balgama ampisilinkinden 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 MÜSTAHAZARLAR

- 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 İV 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.

# 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.