

Aciclovir

Stofgruppe:
Nucleotid analoger

Indtagelse: opisk, i.v., p.o., øjensalve.

Virkning: Nukleosidanalog, kræver fosforylering af herpespecifikke kinase til nukleotid og siden til triphosphat for at være aktivt → hæmmer viral DNA-polymerase (indbygges i konkurrence med dGTP uden virkning).

Indikation: HSV, VZV, EBV, CMV og HHV-6.
CMV forebyggelse hos transplanterede.

Bivirkning: Kvalme, hovedpine, renal dysfunktion. HUS, Trombocytopeni.

Amantadine

Stofgruppe:
Viral uncoating-hæmmere

Indtagelse: P.O.

Virkning: Binder til og blokerer M2-protein (en protonselektiv ionkanal) i virus' kapsel → hæmmer viral uncoating

Indikation: Influenza A

Bivirkning: GI-sympt. Og neurologiske effekter som insomni, svimmelhed, konc.besvær.

Amoxicillin

Stofgruppe: Bredspektrede penicilliner. Cellevægssyntesehæmmer.

Indtagelse: p.o.

Virkning: Baktericid, tidsafh. drab. Gør β -lactamring ustabil. Binder til transpeptidaserne → hæmmer peptidoglycanlagets dannelse → cellevæg svækkes og sprænges (kun delende celler). Beta-lactamringen ligner D-alanin-D-alanin.

Indikation: G+ (mindre potent) & G-
Stave., Penicillin følsom HiB, P. mirabilis, E. coli, E. faecalis, H. pylori (kombi med metronidazol). Udvidet spektrum opnås i kombi med beta-lactamase hæmmeren clavulansyre (luftveje, H. influenza, N. gonorrhoea)

Bivirkning: påvirker normal flora. Allergi (øget tendens ifht. Alm penicillin). Sjældent drug feber, hududslæt, anafylaktisk shock.

Amphotericin

Stofgruppe: Polyener
Indtagelse: i.v.

Virkning: Fungicid. Bindes til steroler og ergosterol så celledembranen beskadiges → et mest bredspektrede antimykotika. Snævert terapeutisk indeks.

Indikation: Systemisk og profund svampeinfektion med candida, cryptococcus, aspergillus samt sjældne mykoser.

Kombi af flucytosin og amphotericin B (synergisme) ved candidaendophthalmitis, -meningitis og endocarditis og Cryptococcosis i CNS.

Interaktion med nyremedicin, antiarytmika, corticosteroid.

Bivirkning: Nyretoksicitet, infusionsrelateret kulderystelser og feber.

Benzylpenicillin (Penicillin G)

Stofgruppe: Smalsp. penicilliner.
Cellevægssyntesehæmmer.
Indtagelse: i.v.

Virkning: Baktericid, tidsafh. drab.
Binder til cellevægspoteinerne → inhib. peptidoglycanlagets dannelse → cellevæg svækkes og sprænges (kun delende celler). Beta-lactamringen ligner D-ala-D-ala
Hurtig fordeling også IC.

Indikation: mere potent end V.
-G+ Stave & kokker (90 % S. aureus resistens) Incl streptokok (alfa hæm: pneumoni, sinuit, otitis media. Beta hæm: pharyngit) sepsis, meningit, gasgangræn (C. perfringens)
-G- Kok og spirøkæter: Neisseria meningit og gonokok, borrelia og syfilis)

Bivirkning: allergi, krampe, nefrotoksisk, ændret normal flora (jf. superinfektion med C. difficile)

Azithromycin

Stofgruppe: Proteinsynteseinhib. - Makrolider
Indtagelse: P.O.

Virkning: Bakteriostatisk: Binder reversibelt til 50S-delen af bakteriernes ribosomer → proteinsyntesen hæmmes.
Passerer ikke BBB. Mange interaktioner.

Indikation: G+ Primært til s. pneumoniae, Beta hæm-streptokok (S. pyrogenes) – pneumoni, tonsilit, erysipelas, clamydia, corynebacteriae. G neg diplokok små G- stave: B. pertussis, Legionella, H. pylori (ikke H. influenzae)

Bivirkning: Har færre bivirkninger end erythromycin. GI-symp: kvalme, diarré, abdominalsmerter. Forlænget Q-T. Sjældent allergi.

Atazanivir

Stofgruppe: Proteasehæmmere
Indtagelse: P.O.

Virkning: HIV-proteasehæmmer → spaltningen af det virale precursor-polyprotein bremses → umodne ikke-infektive viruspartikler.

Indikation: HIV
Kontraindikationer: Nedsat leverfunktion. Samtidig anvendelse af rifampicin, perikon, lægemidler, der nedbrydes via CYP3A4. Mange interaktioner.

Bivirkning: Toxiske med stor betydning for compliance. Forhøjet bilirubin. Kvalme, diarré, forhøjede levertal, GI-sympt., Resistensudvikling.

Ampicillin

Stofgruppe: Bredspektrede penicilliner.
Cellevægssyntesehæmmer.
Indtagelse: p.o & i.v.

Virkning: Baktericid, tidsafh. drab.
Binder til transpeptidaserne → hæmmer peptidoglycanlagets dannelse → cellevæg svækkes og sprænges (kun delende celler). Beta-lactamringen ligner D-alanin-D-alanin

Indikation: : G+ (mindre potent) & G- Stave; Penicillin følsom HiB, P. mirabilis, E. coli, E. faecalis, Høj konc. I urin og galde, derfor god til UIV og galde . Ofte i kombination med aminoglykosid.

Bivirkning: påvirker normal flora. Allergi. Sjældent drug feber, hududslæt, anafylaktisk shock. pseudomembranøs colitis.

Ciprofloxacin

Stofgruppe: (fluo)Quinolon.
DNA-replikationsinhibitorer

Indtagelse: P.O.

Virkning: Bredspektret. Bakteriocid.

Hæmmer det bakteriespecifikke DNA-gyrase, der inducerer neg. supercoiling → hæmmer DNA-synt. i hvilende og voksende bakterier → Konc.afh. drab.

Indikation: Alvorlige inf. Enterobacteriace, Neisseria, Pseudomonas, Haemofilus, Bordetella, Legionella og S. typhi/paratyphi. Bærer af meningitidis.

Ved alvorlige infektioner med Pseudomonas aeruginosa kombi m. aminoglykosid og/eller et β-lactam.

Bivirkning: GI-symp: bruskdannelsen hos børn = kontra.. Resistens: stigning i resistens hos *E. coli* og *Klebsiella* sp., 10-20% er resistente. Ca. 70% af ESBL-producerende *E. coli* og *Klebsiella* sp. er også resistente.

Cefuroxim (Zinacef)

Stofgruppe: Cephalosporiner (2. gen.)
Cellevægssyntesehæmmer.
Bredspektret.

Indtagelse: i.v.

Virkning: Bacteriocid. Konc. Afh. Drab.
T $\frac{1}{2}$ 1 timer, nyredskillelse

Indikation: Til alvorlige infektioner med uklar ætiologi (bredspektrede), hvor penicillin ikke kan bruges fx pga. allergi. God penetration over BBB. Sepsis, meningokok profylakse, gonore.
G pos: S. pneumoniae, a-hæm streptokokker og β-hæm streptokokker.
Især *G. neg bakterier*: *E. coli*, *Proteus* sp., *Morganella morganii*, *Klebsiella* sp., visse *Enterobacter* sp., *H. influenzae*, *B. catarrhalis*, *Pasturella* sp., *N. meningitidis* og *N. gonorrhoeae*.

Bivirkning: Primær ugiftig. Nefrotoxisk, allergi. P.o: GI-gener. I.m: flebit.
Resistens: MRSA

Ceftriaxon

Stofgruppe: Cephalosporiner (3. gen.)
Cellevægssyntesehæmmer.
Bredspektret

Indtagelse: i.v.

Virkning: Bacteriocid. Konc. Afh. Drab.
T $\frac{1}{2}$ 8 timer, galdeudskillelse.

Indikation: Til alvorlige infektioner med uklar ætiologi (bredspektrede), hvor penicillin ikke kan bruges fx pga. allergi. God penetration over BBB. Sepsis, meningokok profylakse, gonore.
G+: S. pneumoniae, a-hæm streptokokker og β-hæm streptokokker.
Primært G- bakterier.

Bivirkning: Primær ugiftig. Nefrotoxisk, allergi. P.o: GI-gener. I.m: flebit.
Resistens: MRSA og nogle ESBL

Caspofungin

Stofgruppe: Echinacandiner

Indtagelse: i.v.

Virkning: Fungicid. Hæmning af glucansyntetase → inhib. specifikt svampens cellevægssyntese → cellelyse.

Indikation:

Fungicid: Candida,

Fungistatisk: Aspergillus.

Ingen effekt: Cryptococcus.

Mindre toksik end Amphotericin B → foretrukket ved neutropeni pt og spædbørn med invasiv svampeinfektion.

Interaktion med Ciclosporin, Rifampicin.

Bivirkning: Ubetydelige. Feber, GI, Tromboflebit ved indstik.

Clavulansyre

Stofgruppe: β -lactamasehæmmer.

Indtagelse: p.o. (smn. m. amoxicillin)

Virkning: Penicillinlignede stof med ringe antibakteriel effekt. Binder irreversibelt til β -lactamase \rightarrow inhib. Amoxicillin nedbrydes.

Indikation: Inf. m.

amoxicillin/clavulansyre-løsomme bakterier, fx øvre- og nedre luftvejsinfektioner.

Kontraindikationer: Penicillinallergi, mononukleose.

Bivirkning: Diarré. Kvalme, opkastning, abdominalsmerter, Candidiasis i hud og slimhinder, hududslæt, hudkløe.

Dicloxacillin

Stofgruppe: β -laktamase stabile, penicilliner

Cellevægssyntesehæmmer.

Indtagelse: i.v & p.o.

Virkning: bacteriocid, tidsafh. Drab. 10 X mindre potent end alm. Penicillin G. og derfor ikke indiceret ved øvrige G+ Bakterier.

Indikation: infektioner med penicillinase stabile stafylokokker. (90 % S. aureus).

Bivirkning: Allergi

Doxycyclin

Stofgruppe: Tetracycliner

Proteinsyntesehæmmer

Indtagelse: p.o.

Virkning: Bakteriostatisk. Binder reversibelt til 30 S-delen af ribosomerne \rightarrow proteinsyntesen hæmmes. Desuden effekt på visse protozoer – herunder til malaria profylakse med kinin og chloroquinresistent.

Indikation: Bredspektret, men snæver indikation: Acne, clamydia, borrelia, malaria, syfilis. BBB penetration.

Bivirkning: Bindes i knogler og tænder og er derfor kontraindiceret ved graviditet i 2-3 trimester.

Enfuvirtid (T20)

Stofgruppe: Fusions- og entryhæmmere

Indtagelse: S.C. 2X dgl

Virkning: Hæmmer gp41-medieret fusion af HIV og cellemembran.

Indikation: I kombinationsbehandling med andre antivirale midler til HIV-smittede som er resistente overfor/ikke tåler andre antivirale behandlinger.

Bivirkning: Vægttab, perifær neuropati, Guillan Barre. Renal insuf. Neutropeni, trombocytopeni, eosinofili.

Erythromycin

Stofgruppe:

Proteinsynteseinhib. - Makrolider

Indtagelse: P.O.

Virkning: Bakteriostatisk : Binder reversibelt til 50S-delen af bakteriernes ribosomer → proteinsyntesen hæmmes. Passerer ikke BBB. Mange interaktioner. Ikke anvendelse til gravide i 1. trim.

Indikation: G+ Primært til s.

pneumoniae, Beta hæm-streptokok (S. pyrogenes) – pneumoni, tonsillit, erysipelas, clamymdia, corynebacteriae. G neg diplokok små G- stave: B. pertussis, Legionella, H. pylori (ikke H. influenzae)

Bivirkning: GI-symp: kvalme, diarré, abdominalismerter . Forlænget Q-T. Sjældent allergi.

Fluconazol

Stofgruppe: Azol

Indtagelse: p.o, i.v.

Virkning: Fungistatisk.Hæmmer et cyt. P450-afhængigt enzym → inhib. ergosterolsyntesen → øget cellemembranspermeabilitet.

Indikation : Lokal, systemisk, profund svampeinfektion: Gærsvampe, mindre aktivt over for dermatofyter og inaktivt over for skimmelsvampe.

Kontraindikation: Erythromycin.

Bivirkning: Kvalme, GI, anæmi, leverinsufficiens. Resistensudvikling

Flucytosin

Stofgruppe: Nucleotidanalag

Indtagelse: i.v.

Virkning: Fungistatisk. Højdosis fungicid. Transporteres ind i sensitive celler (humane celler kun i ringe grad) → IC-metaboliseres og inkorporeres i DNA og RNA → forstyrrer syntesen. Kun som kombinationsbehandling for at modvirke resistensudvikling. Snævert terapeutisk indeks.

Indikation: Specialistbehandling.

Systemiske og profunde svampeinfektioner: Kombination af flucytosin og amphotericin B (synergisme) ved candidaendophthalmitis, -meningitis og -endocarditis og ved Cryptococcosis i CNS.

Bivirkning: Knoglemarvsdepression, GI-gener

Foscarnet

Stofgruppe:

Non-nucleosid RT (& DNA polymerase)-hæmmere (NNRTI)

Indtagelse: P.O.

Virkning: poly peptidanalag hæmmer funktionen af en række virale DNA-polymeraser og den HIV specifikke RT. Behøver ikke fosforylering for akt. (direkte binding, ingen konkurrence)

Indikation: HIV, Herpesgruppen: CMV, VZV, HSV.,(EBV, HHV 6 og 8).

Bivirkning: Nefropati (ofte reversibel), elektrolyt forstyrrelser, slagtilfælde., anæmi, feber, GI gener.

Fusidinsyre

Stofgruppe: Proteinsyntesehæmmer

Indtagelse: p.o., i.v., salve, creme, øjendråber

Virkning: Bakteriostatisk : binder til elongeringsfaktor i proteinsyntesen (30 s-delen) → inhib. Proteinsyntese.

Indikation: Anerobe bakterier og Stafylokokker. Ofte i kombi med Clindamycin, Rifampicin, Makrolid. ikke effekt på H. influenzae

Bivirkning: G.I gener, gulsot, neutropeni, allergi.

Ganciclovir

Stofgruppe: Nukelinsyre analog

Indtagelse: i.v.

Virkning: Hæmmer DNA-syntesen specifikt i herpesinficerede celler (jf. aciclovir).

Indikation: Følsomme humane herpesvirus: CMV, HSV 1, 2, HHV 6 og 8, EBV og VZV.

Bivirkning: feber, kvalme, opkast, GI, dyspnø, neutropeni, trombocytopeni, flebit, anæmi.

Gentamycin

Stofgruppe: Proteinsynteseinhib. - aminoglykosider

Indtagelse: I.V. eller I.M.

Virkning: Baktericidit , konc. afh. drab (1xdg!); inder irreversibelt til 30S-delen af bakterierne ribosomer → hæmmer proteinsyntese.
Har 'post-antibiotisk effekt' (PAE) som varer i ca 10-12 timer. Synergistisk effekt, når aminoglykosider gives i kombination med betalactam penicillin
Bør aldrig gives alene til systemiske inf.
Dårlig BBB penetration.

Indikation: Alvorlige inf. med G- stave (G- diplokok kun lidt følsom), sepsis, endokardit, meningitis, UVI, peritonitis.
Sjældent G+, dog S. aureus (i kombi med beta-lactam til endocardit)

Bivirkning: Allergi, oto- og nefrotoxicitet. Neuromuskulær blokade.

IFN α, β og γ

Stofgruppe: interferoner

Indtagelse: i.v, s.c. (dyrt)

Virkning: Hæmmer ribosomal syntese af viruspecifikke proteiner og dermed virusreplikationen samt immun-systemets cellevækst og differentiering. Stimulering af monocytter og makrofag.

Indikation:

α : Hepatitis B, C. Maligne sygdomme.

β : Dissemineret sclerose

γ : kronisk granulomatøs sygdom

Kontraindikation: kronisk hepatitis med levercirrose. Immunsupprimerede.

Alvorlig CNS- og hjertelidelse. Epilepsi.

Lever-nyresvigt. Samtidig indgift med immunologiske præp., fx vacciner, pga.

risiko for uventet øget immunrespons.

Bivirkning: Lokal injektions reaktion – sjældent nekrose. Influenza symptomer. Hypocalcæmi. Leukopeni. Anæmi. Depression.

Indinavir

Stofgruppe:
Proteasehæmmere

Indtagelse: P.O.

Virkning: HIV-proteasehæmmer → spaltningen af det virale precursor-polyprotein bremses → umodne ikke-infektøse viruspartikler.

Indikation: HIV

Bivirkning: Toxiske med stor betydning for compliance. Kvalme, diarré, forhøjede levertal, trombocytopeni, GI-sympt., hyperkolesterolemie. Resistensudvikling.

Klindamycin

Stofgruppe: Klindamycin – proteinsyntesehæmmer

Indtagelse: p.o., i.v.

Virkning: Bakteriostatisk.

Binder reversibelt til 50S ribosomer → hæmmer proteinsyntesen.

Indikation: Alvorlige inf. ved resistens eller allergi. G+ kok, Anaerobe bakterier. En del Clostridium sp. er resistente. G- stave, Neisseria sp. og E. faecalis er resistente. Endocardit profylakse. Nekrotiserende fasciit.

Bivirkning: G.I

Kloramphenikol

Stofgruppe: Proteinsyntesehæmmere. bredspektret

Indtagelse: Øjendråber /salve (i udv. Lande i.v. til meningit)

Virkning: Bakteriostatisk : Bindes reversibelt til 50 S-delen af ribosomerne → proteinsyntesen hæmmes.

Indikation: Bredspektret til øjne; G- Kok og stave incl anaerobe . Mindre potent til G+ kok og stave.

Bivirkning: toksisk systemisk. "Gray baby syndrome": reversibel og irreversibel knoglemarvshæmning., allergi

Lamivudin

Stofgruppe:
Nucleosid RT-hæmmere (NRTI)

Indtagelse: P.O.

Virkning: IC fosforylering til akt. Metabolit konkurrerer om det aktive site) → hæmmer HIV/HBV specifikke RT efter → virus kan ikke danne enkeltstrengede RNA.

Indikation: HIV, hepatitis B.

Bivirkning: Milde: Utilpashed, hovedpine, GI-symp., udslett, søvnløshed mfl.

Metronidazol

Stofgruppe: DNA-replikation hæmmer.

Indtagelse: i.v., p.o.

Virkning: I amøber og mikroorganismer med strikt anaerobt stofskifte omdannes det til aktive metabolitter → binder til DNA → brud på DNA-strengene.

Indikation: Baktericid: Strikt anerobe bakterier & protozoer .
Abscesser, sårinfektioner i tarm og interne genitalier. Profylaktisk ved tarm og gyn. kirurgi. Ved mistanke om blandingsinfektion.
Kombinationsbehandling.

Nedsat dosering ved alvorlig leverinsufficiens. Frarådet alkoholindtag under behandlingen pga. antabuslignende reaktion.

Bivirkning: G.I., leverpåvirkning, leukopeni, svimmelhed.

Meropenem

Stofgruppe: Carbapenemer.
Bredspektret.

Indtagelse: i.v.

Virkning: Højere aff. til cellevægsproteiner end øvrige β -lactamer → danner protoplaster (= uden cellevæg), → meget labile og lyserer let → baktericidit på bakterier i vækst.
Pga. sidekædens struktur og placering er β -lactamringen effektivt beskyttet mod β -lactamaser. Passerer BBB.

Indikation: G- (primært) og G+ anerobe og aerobe. Anvendes kun til alvorlige inf. ESBL, Listeria. Kombi med aminoglykosid (Gentamycin) el. Ciprofloxacin ved nedsat følsomhed.

Bivirkning: Som for cephalosporiner.
Primær ugiftig. Nefrotoksik, allergi. P.o: GI-gener. I.m: flebit. Resistens: MRSA, S. epidermidis .

Mecillinam

Stofgruppe: Penicilliner med overvejende virkning på gramnegative stave. Cellevægssyntesehæmmer.

Indtagelse: p.o & i.v.

Virkning: Baktericid, tidsafh. drab. Gør β -lactamring ustabil. Binder til transpeptidaserne → hæmmer peptidoglycanlagets dannelse → → cellevæg svækkes og sprænges (kun delende celler). Beta-lactamringen ligner D-alanin-D-alanin

Indikation: G- Stave. Enterobacteria (E. coli, klebsiella), ESBL. Ikke effekt på G+ og anerobe bakterier. UVI , høj konc. I urin.

Bivirkning: Allergi

Linezolid

Stofgruppe: Oxazolidinoner, proteinsyntesehæmmer

Indtagelse: p.o.
Abs. 100%

Virkning: Bakteriostatisk : hæmmer initieringskompleks (70 s). Desuden reversibel non-selektiv MAO-hæmmer.
God BBB penetration.

Indikation: specialist beh. Af alvorlige inf. med G+ incl MRSA, E. faecalis, VRE. Anerobe inkl. C. perfringens, C. difficile. Ikke effekt på G- Pneumoni og komplicerede hud- og bløddelsinfektioner

Bivirkning: smagsforstyrrelser, kvalme, leverpåvirkning mfl. Mange interaktioner.

Monobactam

Stofgruppe: Beta-Lactam antibiotika.
 Cellevægssyntesehæmmer
 Smalspektret
Indtagelse: i.v.

Virkning: Baktericid, tids afh. drab.
 Binder til transpeptidaserne →
 hæmmer peptidoglycanlagets dannelse
 → hæmmer cellevægssyntesen →
 cellevæg svækkes og sprænges (kun
 delende celler). Beta-lactamringen
 ligner D-ala-D-ala. Passerer dårligt
 BBB. Passerer placenten.

Indikation: Specialist behandling. G-
 ved penicillin allergi eller resistens.
 Syntergistisk effekt med aminoglykosid
 (Gentamycin).

Bivirkning: sjældent. Udslet, forhøjet s-
 aminotransferase

Nevirapin

Stofgruppe:
 Non-nucleosid RT-hæmmere (NNRTI)
Indtagelse: P.O.

Virkning: Hæmmer RT non-kompetitivt
 ved allosterisk binding til enzym.
 Behøver ikke fosforylering for akt.
 (direkte binding, ingen konkurrence)

Indikation: HIV

Bivirkning: Hududslæt, kvalme,
 træthed, feber. Psykiske bivirkninger
 (depression, selvmordstruet).
 Levertoxisk og kræver derfor tæt
 monitorering. Ofte resistens udvikling.

Nystatin

Stofgruppe: Pylener
Indtagelse: Peroral suspension (lokal
 behandling)

Virkning: Fungicid: Bindes til steroler
 og ergosterol så celledmembranen
 beskadiges → defekt osmolytisk
 balance.

Indikation: Oral og øsofageal infektion
 med candida- trøske (o.a. nystatin
 følsomme svampe)

Bivirkning: kvalme, G.I.

Oseltamivir (Tamiflu)

Stofgruppe:
 Neuraminidasehæmmer
Indtagelse: P.O.

Virkning: Hæmmer neuraminidase
 (influenza-overflade-enzym) →
 luftvejsekretet opretholder viskositet →
 virus klumper sammen → virus ikke
 kan undslippe inficeret celle.

Indikation: profylakse (forkorter
 influenza tiden med 1-2 døgn, hvis
 givet inden for 48 timer) og behandling
 af Influenza A og B.

Bivirkning: Hovedpine, kvalme, opkast.
 Bronkiespasme, respirations
 depression.

Palivizumab

Stofgruppe:
Fusions- og entryhæmmere

Indtagelse: I.M.

Virkning: Humaniseret IgG₁ monoklonalt antistof fra mus : binder A-antigene epitop på fusionsproteinet af respiratorisk syncytialvirus (RSV).

Indikation: RSV. Forebyggende behandling af alvorlige RSV-infektioner hos præmature og børn med kronisk lungesygdom.

Bivirkning: Feber, diarré.

Phenoxymethylpenicillin (Penicillin V)

Stofgruppe: Smalspektret penicilliner.
Cellevægssyntesehæmmer.
Indtagelse: p.o., syrestabil

Virkning: Baktericid, tidsafh. drab. mindre potent end penc. G. pga. langsommere penetration. Derfor aldrig til akut beh.
Hæmmer cellevægssyntesen ved binding til proteinerne og derved hæmme peptidoglycanlagets dannelse → cellevæg svækkes og sprænges (kun delende celler). Beta-lactamringen ligner D-ala-D-ala

Indikation:
- G+ Stave & kokker (90 % S. aureus resistens) .

Bivirkning: Allergi :G.I (kvalme, opkast, diare)

Piperacillin

Stofgruppe: Penicillin kombineret med beta-lactamasehæmmere (tazobactam)
Cellevægssyntesehæmmer.
Indtagelse: i.v.

Virkning: Baktericid, tidsafh. drab. Gør β-lactamring ustabil. Hæmmer cellevægssyntesen ved at binde til transpeptidaserne og derved hæmme peptidoglycanlagets dannelse → cellevæg svækkes og sprænges (kun delende celler). Beta-lactamringen ligner D-alanin-D-alanin

Indikation: Alvorlige infektioner m. Pseudomonas. E. Coli, Enterobacterier, E. faecalis, B. fragilis. Fx nokosomielle pneumoni, sepsis, intraabdominale infektioner. (Som for clavulansyre er der ikke effekt overfor alle beta-lactamaser.

Bivirkning: allergi

Raltegravir

Stofgruppe: HIV-Integrase æmmer
Indtagelse: p.o.

Virkning: HIV-integrasehæmmer. Hindrer den kovalente integration af HIV-genomet i værtsgenomet og dermed udbredelse af virusinfektionen.

Indikation: HIV, kombinationsbehandling

Bivirkning: Træthed, GI-symp., forhøjede levertal, triglycerider, kreatinkinase. Svimmelhed, søvnløshed, udslet, svedtendens.

Ribavirin

Stofgruppe: Viral RNA- og DNA-syntesehæmmer.
Indtagelse: p.o. (i.v. ved Lassafeber)

Virkning: Virkningen er ikke klarlagt i detaljer; fosforyleres af cellens enzym og indvirker på nukleinsyresyntesen. Derudover interfererer ribavirin med den posttranskriptionelle modifikation af virus-specificeret m-RNA → inhib. ribosomale translation af viral m-RNA. Det mest bredspektrede antivirale middel, men med snæver anvendelse
Kontraindikation: nedsat lever/nyrer. funktion. Autoimmun hepatitis, thyroideasygdom.

Indikation: Hepatitis C i kombination med interferon. (Lassa feber)

Bivirkning: anoreksi, kvalme, diare, udslett, træthed, anæmi, forhøjet bilirubin, leukopeni.

Rifampicin

Stofgruppe: RNA-polymerase hæmmer
Indtagelse: p.o.

Virkning: Bakteriostatisk: binder subunit på den bakterielle RNA-polymerase → hæmmer transkriptionen. Passerer ikke den normale blod-hjernebarriere, men ved tuberkuløs meningitis kan opnå koncentrationer i spinalvæsken.

Indikation: Mycobacterier (TB -4-stof behandling med Isoniazid, Ethambutol og Pyrazinamid. Lepræ), G+ (S. aureus udvikler let resistens), Legionella.

Bivirkning: Rødfarvet urin og tårer, leverpåvirkning, Steven Johnson, konglemarvsdepression. Interaktion med P-piller og p450.

Ritonavir

Stofgruppe: Proteasehæmmere (Booster)
Indtagelse: p.o.

Virkning: HIV-proteasehæmmer → spaltningen af det virale precursor-polyprotein bremses → umodne ikke-infektøse viruspartikler.

Indikation: HIV anvendes i kombinationsbehandling som booster med andre proteasehæmmere.

Bivirkning: Toxiske med stor betydning for compliance. Kraftesløshed. Smagsforstyrrelser, kvalme, opkastning, abdominalsmerter, diarré. Hovedpine og resistensudvikling.

Saquinavir

Stofgruppe: Proteasehæmmere
Indtagelse: P.O.

Virkning: HIV-proteasehæmmer → spaltningen af det virale precursor-polyprotein bremses → umodne ikke-infektøse viruspartikler.

Indikation: HIV

Bivirkning: Toxiske med stor betydning for compliance. Kvalme, diarré, forhøjede leveralt, trombocytopeni, GI-sympt., hyperkolesterolæmi. Resistensudvikling.

Sulfonamid

Stofgruppe:
Antimetabolitter
Indtagelse: P.O.

Virkning: Analoger til para-aminobenzoesyre (PABA) → kompetitivt hæmmende på indbygningen af para-aminobenzoesyre i folsyre → hæmmer folsyresyntese (1. trin) → hæmmer DNA-syntese. Bakteriostatisk som mono-, men -ciddt i kombiterapi med Trimetoprim.

Indikation: Malaria, klamydia, brandsår, Pneumocystis jiroveci.

Bivirkning: Let dyspepsi og allergi.

Tazobactam

Stofgruppe: β-lactamasehæmmere.
Indtagelse: p.o. (smn. m. Piperacillin)

Virkning: Penicillinlignede stof med ringe antibakteriel effekt. Binder β-lactamase (OBS! ikke alle!) → inhib. Piperacillin nedbrydes.

Indikation: Inf. m. piperacillin/tazobactamfølsomme bakterier, der er blevet piperacillinresist. Pga. β-lactamaseproduktion.

Kontraindikationer: Allergi over for penicilliner, cefalosporiner og β-lactamasehæmmere.

Bivirkning: Diarré. Kvalme, opkastning, abdominal smerter, Candidiasis i hud og slimhinder, hududsæt, hudkløe.

Terbinafin

Stofgruppe: Terbinafin
Indtagelse: lokalbehandling (Systemisk p.o til dermatofyt behandling)

Virkning: Fungicid: Hæmmer enzymet squalen epoxidase, der katalyserer et tidligt trin i svampens ergosterolsyntese → cellelyse.

Indikation: Hudinfektioner med dermatofyter og candida.

Bivirkning: ubetydelig, ubehag ved applikationsstedet, allergi. (Systemisk: GI-gener, kvalme)

Trimethoprim

Stofgruppe:
Antimetabolitter
Indtagelse: P.O.

Virkning: Hæmmer allosterisk dihydrofolsyreduktase → hæmmer folsyresyntese (2. trin) → hæmmer DNA-syntese. Bakteriostatisk som monoterapi, men bakteriociddt i kombinationsterapi med sulfonamid.

Indikation: UVI, resp. Infektioner .

Bivirkning: Let dyspepsi og allergi.

Vancomycin

Stofgruppe:
Antibiotika, cellevægssynteseinhib.
Indtagelse: I.V. eller P.O.

Virkning: Baktericidit glykopeptid:
Hæmmer de sidste trin af peptidoglycan-biosyntesen → inhib. cellevægsgdannelsen. Høj vævspenetration, dog ikke CNS.

Indikation: alvorlige inf. G+ kokker, især Staphylococcus aureus (incl. MRSA).
G+ stave, især corynebakterier, Listeria sp. og Clostridium difficile.
G- er resistente.

Bivirkning: Allergi, feber, kulderystelser, hududslæt, oto- og nefrotoxicitet. "red man syndrome" (histamin frisætning) vancomycin-højresistente E. faecium (VRE)

Zidovudin

Stofgruppe:
Nucleosid RT-hæmmere (NRTI)
Indtagelse: P.O. i.v.

Virkning: IC fosforylering til akt. Metabolit (konkurrerer om det aktive site) → inhib. HIV specifikke RT → virus kan ikke danne enkeltstrengede RNA.

Indikation: HIV
Kontraindikation: Neutropeni og anæmi.
Samtidig indgift af ganciclovir.

Bivirkning: Milde: hovedpine, kvalme. Hæmatologisk toksicitet: Anæmi og leukopeni kan ses. Særlig forsigtighed ved kompromitteret knoglemarv.

β-lactamholdige stoffer

Stofgruppe:
Antibiotika, cellevægssynteseinhib.
Indtagelse: P.O. eller I.V.

Virkning: Baktericidit:
β-lactamringen virker som substrat for det bakterielle enzym (PBP, en transpeptidase) der producerer peptidoglykan (vigtig bestanddel i bakteriecellevæg). Ved kovalent binding inaktiveres PBP → inhib. Cellevægssyntese → bakterien sprænger

Indikation: G+ og G- bakterier.

Bivirkning: Allergi, hududslæt, kløe.