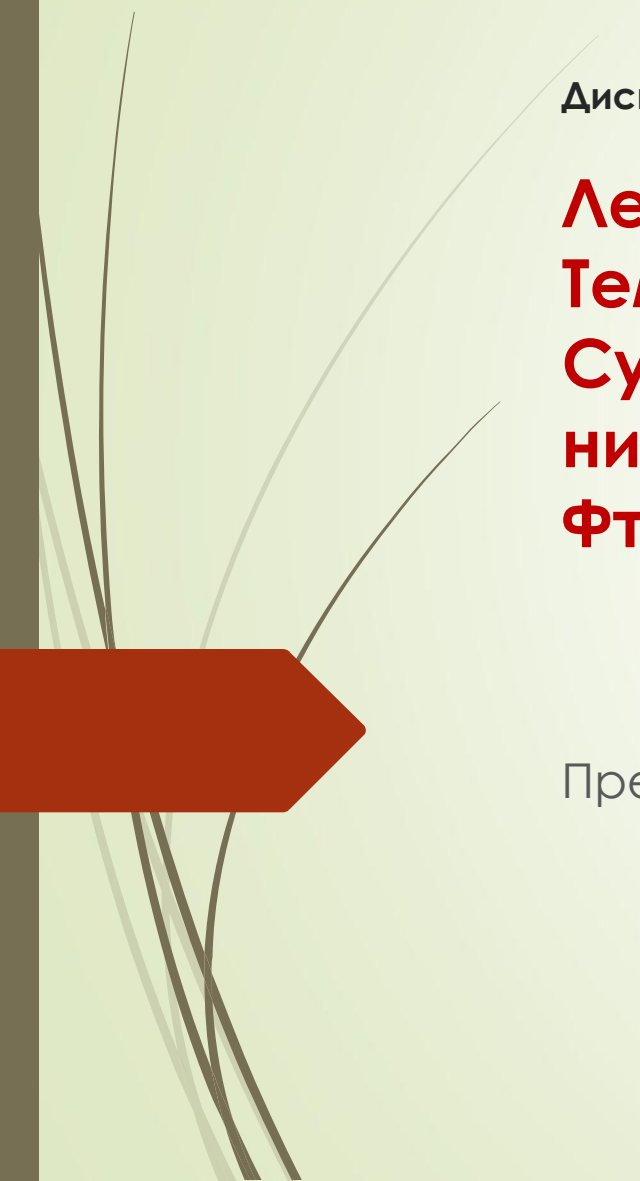




Дисциплина: Фармакология

Лекция 15.

**Тема: Синтетические противомикробные средства.
Сульфаниламидные препараты. Производные
нитрофурана, нитроимидазола. Хинолоны.
Фторхинолоны.**

Преподаватель: к.м.н. Сизова В.В.

СУЛЬФАНИЛАМИДЫ

— это препараты широкого спектра бактериостатического действия. В 1935 г. Герхард Домагк показал химиотерапевтические свойства первого из них — прontosила — при стрептококковых инфекциях.



Сульфаниламидные препараты

являются конкурентными антагонистами (парааминобензойная кислота) **ПАБК**.

СУЛЬФАНИАМИДЫ

Уступают по активности антибиотикам, но имеют преимущества:

1. Малая токсичность (можно применять в амбулаторной практике)
2. Нет противопоказаний в детском возрасте
3. Относительно низкие цены

Препараты обладают бактериостатическим противомикробным эффектом (в условиях иммунодефицита не активны), активны только против делящихся штаммов.

В результате широкого распространения устойчивых микроорганизмов реальный спектр СА значительно сузился.

Из механизма действия СА следует:

1. Препараты **действуют только в высоких концентрациях** (концентрация препарата в месте действия должна превышать концентрацию ПАБК в десятки и сотни раз)
2. СА **малотоксичны для животных клеток** (в том числе для клеток человека) из-за того, что в животных клетках не происходит синтез дигидрофолиевой кислоты (она захватывается готовой). Но в печени происходит гидрирование дигидрофолиевой кислоты под действием фолатредуктазы.
3. В средах с высокими концентрациями ПАБК противомикробная активность препаратов снижается (**нецелесообразно использовать в гнойном очаге**)
4. **Микроорганизмы становятся резистентным** к действию СА, если синтезируют ПАБК в больших количествах.

Классификация СА

- Хорошо всасываются в ЖКТ и обладают резорбтивным действием
- Короткие (8ч) – стрептоцид, этазол, норсульфазол, сульфадимезин
- Средние (8-16ч) – сульфадиметоксин
- Длительные (24-48ч) – сульфален
- Плохо всасывающиеся в ЖКТ – фталазол, сульгин
- Комбинированные
 - с триметропином – ко-тримоксазол (бактрим, бисептол)
- Для местного применения – сульфацил-натрий

Назначение СА

- СА, хорошо всасывающиеся в ЖКТ, в связи с чем, они назначаются **для систематической лечения инфекций, вызванных чувствительными микроорганизмами:**
- СА, плохо всасывающиеся в ЖКТ и создающие высокую антибактериальную концентрацию в тонком и толстом кишечнике, назначаются только внутрь. Применяют эти препараты для лечения **острых энтеритов, бактериальной дизентерии, колитов и энтероколитов.** Обычно их назначают 4-6 раз в сутки в средних дозах 4-6 грамм в течение 5-7 дней.
- СА для местного применения: сульфацил натрий, альбуцид в виде глазных капель и глазной мази 30%, назначают при воспалительных **заболеваниях конъюнктивы глаза, блефаритах, гнойных язвах роговицы; весьма эффективен при трахоме.**
- Комбинированные препараты **оказываются эффективными в тех случаях, когда лечение только сульфаниламидами было безуспешным.** Максимальные концентрации в крови обнаруживаются через 1-4 часа. Бисептол назначают дважды в сутки. Выпускается в таблетках для взрослых по 0, 48, для детей 0, 12 и суспензию 0, 24 в 5 мл (флаконы по 100 мл) для детей младше 12 лет.

Схема назначения сульфаниламидов

В первый день лечения сульфаниламиды назначают в высоких ("ударных") дозах и затем переходят к лечению поддерживающими дозами. Величину доз и частоту приемов сульфаниламидов устанавливают в зависимости от длительности действия препаратов

Сульфаниламидные препараты	Дозы и режим приемов		
	1-ый день приема		Последующие дни приема
	«ударная»	Последующие приемы	
Короткого (8 ч)	2 г	По 1 г 5 раз в день	По 1 г 4-6 раз в день
Среднего (8-16 ч)	2 г	По 1 г 3 раза в день	По 1 г 3 раза в день
Длительного (24-48 ч)	1-2г	-	По 1 г 1 раз в день

Показания к применению СА

- инфекции глаз (**местного действия**);
- инфекции дыхательных путей и мочевыводящих путей (**резорбтивного действия**);
- колиты, энтероколиты, другие воспалительные заболевания кишечника (**плохо всасывающиеся в ЖКТ**);

Побочные явления:

- аллергические реакции
- Диспептические явления (тошнота, рвота, диарея)
- кристаллурия
- нарушение кроветворения (лекопения, тромбоцитопения, гемолиз эритроцитов).

Правила хранения: Список хранения Б. В защищенном от солнечных лучей месте в герметичной упаковке.

Примеры рецептов

Rp.: Sulfadimezini 0,5

D.t.d. N. 40 in tabulettis

S. По 2 таблетки 4 раза в день.

Rp.: Sol. Sulfacyli-natrii 20%-10 ml

D.S. По 2 капли в каждый конъюнктивный мешок 5–6 раз в сутки

Rp.: Sulfadimethoxini 0,5

D.t.d. N. 20 in tabulettis

S. В первый день принять 2 таблетки однократно;
в последующие дни по 1 таблетке 1 раз в день.

Rp.: Tab. Biseptol 0,48 № 20

D.S. По 2 таблетки 2 раза в день после еды.



Фторхинолоны

ФТОРХИНОЛОНЫ – фторированные производные хинолона, действуют бактерицидно, на ГР+ и ГР- бактерии; активны в отношении синегнойной палочки.

Хинолоны классифицируют по времени введения в практику новых препаратов с улучшенными антимикробными свойствами. Согласно рабочей классификации, предложенной R. Quintiliani (1999), хинолоны разделяют на четыре поколения.

Классификация хинолонов

I поколение - нефторированные	II поколение - «грамотрицательные»	III поколение - «респираторные»	IV поколение - «респираторные»+ «антианаэробные»
<u>Налидиксовая кислота</u> (невиграмон)	<u>Ципрофлоксацин</u> <u>Ломефлоксацин</u>	Спарфлоксацин <u>Левифлоксацин</u>	<u>Моксифлоксацин</u>

ХИНОЛОНЫ I ПОКОЛЕНИЯ

НАЛИДИКСОВАЯ КИСЛОТА (*Невиграмон, Неграм*) **Acidum Nalidixicum**

Фармакокинетика: Хорошо всасывается в ЖКТ, особенно натощак, но при этом хуже переносится. Высокие концентрации создаются только в моче. При щелочной реакции мочи антимикробный эффект усиливается. $T_{1/2}$ - 1-1,5 ч.

Спектр активности: Грам(-) палочки: E.coli, шигеллы, сальмонеллы, протей, клебсиеллы. Синегнойная палочка, грамположительные кокки и анаэробы устойчивы.

Нежелательные реакции: Диспептические расстройства. Цитопении. Гемолитическая анемия. Возбуждение ЦНС (понижение судорожного порога). Холестаз.

Лекарственные взаимодействия Нельзя сочетать с нитрофуранами.

Показания

- Инфекции МВП у детей: преимущественно цистит, терапия хронического пиелонефрита.
- Шигеллез у детей. У взрослых при этих заболеваниях лучше применять фторхинолоны.

Предупреждение Ввиду того, что в ткани почек создается низкая концентрация препарата, его не рекомендуется применять при остром пиелонефрите. **Противопоказания** Почечная недостаточность.

Дозировка

Взрослые Внутрь - по 0,5-1,0 г каждые 6 ч после еды.

Дети старше 3 месяцев Внутрь - 55 мг/кг/день в 4 приёма после еды.

Формы выпуска Таблетки и капсулы по 0,5 г.

ФТОРХИНОЛОНЫ

По фармакодинамике:

□ более широкий спектр активности, включающий:

- стафилококки (в том числе PRSA);
- грамотрицательные кокки (гонококк, менингококк, *M. catarrhalis*);
- грамположительные палочки (листерии, коринебактерии, возбудители сибирской язвы);
- грамотрицательные палочки семейства *Enterobacteriaceae*, включая полирезистентные (*E. coli*, сальмонеллы, шигеллы, протеи, энтеробактеры, клебсиеллы, серрации, провиденции, цитробактеры, морганеллы), *P. aeruginosa*, а также кампилобактеры.

□ отдельные препараты (ципрофлоксацин, офлоксацин, ломефлоксацин и др.) активны против *M. tuberculosis*;

□ действуют на некоторые внутриклеточные микроорганизмы (легионеллы).

По фармакокинетике:

- создают высокие концентрации в крови и тканях при приеме внутрь, причем биодоступность не зависит от времени приёма пищи;
- хорошо проникают в различные органы и ткани: легкие, почки, простату;
- имеют длительный $T_{1/2}$, назначаются 1-2 раза в день.

По переносимости:

- нежелательные реакции со стороны ЖКТ и ЦНС встречаются реже;
- могут быть использованы при почечной недостаточности.

ФТОРХИНОЛОНЫ

Микробиологические особенности хинолонов II поколения:

- малочувствительны большинство стрептококков (в том числе пневмококк), энтерококки, хламидии, микоплазмы;
- не действуют на спирохеты, листерии и большинство анаэробов.

Микробиологические особенности хинолонов III поколения:

- обладают более высокой активностью в отношении пневмококков (включая пенициллинорезистентные) и атипичных возбудителей (хламидии, микоплазмы).

Микробиологические особенности хинолонов IV поколения:

- по антипневмококковой активности и действию на атипичных возбудителей превосходят хинолоны предшествующих поколений;
- обладают высокой активностью против неспорообразующих анаэробов (*B. fragilis* и др.), что дает потенциальную возможность применять их при интраабдоминальных и тазовых инфекциях в виде монотерапии.

ЦИПРОФЛОКСАЦИН

Ciprofloxacinum

Ципробай, Ципринол

Является «золотым стандартом» среди фторхинолонов.

Хорошо всасывается в ЖКТ, биодоступность - 80%. $T_{1/2}$ - 4-6 ч.

Спектр активности, лекарственные взаимодействия - см. выше.

Показания Инфекции НДП (обострение хронического бронхита, нозокомиальная пневмония). Инфекции МВП.

Простатит. Интраабдоминальные и тазовые инфекции (в сочетании с антианаэробными препаратами).

Кишечные инфекции (шигеллез, сальмонеллез).

Тяжёлые инфекции кожи, мягких тканей, костей, суставов. Сепсис. Гонорея. Туберкулёз (препарат II ряда). Сибирская язва (лечение и профилактика).

Дозировка

Взрослые

Внутрь - по 0,5-0,75 г каждые 12 ч независимо от еды; при инфекциях МВП - 0,25-0,5 г каждые 12 ч; при острой гонорее - 0,5 г однократно. Внутривенно капельно по 0,4-0,6 г каждые 12 ч (нельзя вводить струйно). Для лечения сибирской язвы - по 0,4 г каждые 12 ч, внутривенно; для профилактики - по 0,5 г каждые 12 ч внутрь в течение 1-2 мес.

Дети

Внутрь - 10-15 мг/кг/сут в 2 приёма (не более 1,5 г/сут) независимо от еды; внутривенно капельно - 7,5-10 мг/кг/сут в 2 введения (не более 800 мг/сут). Для профилактики сибирской язвы - 10-15 мг/кг/сут в 2 приёма в течение 1-2 мес.

Формы выпуска Таблетки по 0,25 г, 0,5 г и 0,75 г; флаконы (ампулы) с раствором для инузий по 0,2 г и 0,4 г; глазные капли 0,3%.



ЛОМЕФЛОКСАЦИН

Lomefloxacinum

Максаквин

Обладает меньшей антимикробной активностью, чем другие фторхинолоны, особенно в отношении пневмококков. Не действует на *P.aeruginosa*.

Имеет высокую биодоступность при приеме внутрь (около 100%). $T_{1/2}$ - 7-8 ч. Переносится несколько хуже, чем другие фторхинолоны. В частности, чаще вызывает фотосенсибилизацию.

Спектр активности, лекарственные взаимодействия - см. выше.

Показания

Инфекции НДП (обострение хронического бронхита не пневмококковой этиологии).

Инфекции МВП.

В России применяется в комплексной терапии туберкулёза, однако контролируемые клинические исследования не проводились.

Дозировка

Взрослые

Внутрь - 0,4-0,8 г/сут в один прием независимо от еды.

Формы выпуска

Таблетки по 0,4 г; глазные капли.



ЛЕВОФЛОКСАЦИН

Levofloxacin

Таваник

Представляет собой левовращающий изомер офлоксацина. Является основным представителем хинолонов III поколения - так называемых «респираторных» хинолонов, отличительным свойством которых является более высокая, чем у хинолонов II поколения, активность против пневмококков (включая пенициллинорезистентные штаммы), микоплазм и хламидий.

Имеет высокую биодоступность при приёме внутрь - около 100%. $T_{1/2}$ - 6-8 ч.

Спектр активности, лекарственные взаимодействия - см. выше.

Показания

Инфекции ВДП (острый синусит).

Инфекции НДП (обострение хронического бронхита, внебольничная пневмония).

Инфекции МВП.

Инфекции кожи и мягких тканей.

Сибирская язва (лечение и профилактика).

Дозировка

Взрослые

Внутрь и внутривенно (медленно) - 0,5 г один раз в день независимо от еды; при остром цистите - 0,25 г один раз в день в течение 3 дней. Для лечения сибирской язвы - по 0,5 г каждые 12 ч внутривенно, для профилактики - по 0,5 г каждые 12 ч внутрь в течение 1-2 мес.

Формы выпуска

Таблетки по 0,25 г и 0,5 г; флаконы с раствором для инфузий по 0,5 г.



МОКСИФЛОКСАЦИН

Moxifloxacin

Авелокс

Превосходит хинолоны II поколения по активности против пневмококков (включая штаммы, устойчивые к пенициллину и макролидам) и атипичных патогенов (хламидии, микоплазмы).

В отличие от всех других фторхинолонов хорошо действует на неспорообразующие анаэробы, в том числе на *B.fragilis*. Несколько уступает ципрофлоксацину по активности в отношении грамотрицательных бактерий семейства *Enterobacteriaceae* и синегнойной палочки.

Биодоступность при приеме внутрь - 90%. $T_{1/2}$ - 12-13 ч.

Спектр активности, лекарственные взаимодействия - см. выше.

Показания

Инфекции ВДП (острый синусит).

Инфекции НДП (обострение хронического бронхита, внебольничная пневмония).

Инфекции кожи и мягких тканей.

Дозировка

Взрослые

Внутрь - 0,4 г один раз в день независимо от приёма пищи.

Форма выпуска

Таблетки по 0,4 г.



Примеры рецептов

Кислота налидиксовая (Acidum Nalidixicum)

Rp.: Tab. Acidi Nalidixici 0,5 N 56

D.S. по 1 таблетке 4 раза в сутки

Ломефлоксацин (Lomefloxacinum)

Rp.: Tab. Lomefloxacini 0,4 N 10

D.S. по 1 таблетке 1 раз в сутки

Ципрофлоксацин (Ciprofloxacinum)

Rp.: Tab. Ciprofloxacini 0,5 N 10

D.S. по 1 таблетке 2 раза в сутки в течение 5 суток

ЛЕВОФЛОКСАЦИН (Levofloxacin)

Rp.: Levofloxacini 0,5

D.t.d.N.10 in tab.

S. по 1 таблетке 2 раза в сутки

МОКСИФЛОКСАЦИН (Moxifloxacin) син. Авелокс (Avelox)

Rp.: Tab. «Avelox» N 5

D.S. по 1 таблетке в сутки в течение 5 суток

Производные 8 оксихинолина

Эта группа препаратов обладает антибактериальным действием. Эта группа препаратов обладает антибактериальным, противогрибковым и выраженным противопротозойным действием. Эта группа препаратов обладает антибактериальным, противогрибковым и выраженным противопротозойным действием. Противомикробное действие связано с образованием комплексных соединений с ионами металлов, что приводит к нарушению ферментных систем микроорганизмов. Устойчивость развивается медленно и не достигает высокого уровня. Первым препаратом этой группы был ОКСИХИНОЛИН (ХИНОЗОЛ), сохранивший свое значение и сейчас. Применяется местно как антисептик, не оказывает раздражающего действия, активность не снижается в присутствии гноя.

В группу производных 8-оксихинолина входят некоторые галоидные производные: энтеросептол и его препараты, интестопан, а также нитросоединение — нитроксолин (5-НОК). Галоидные производные оксихинолина (не нитроксолин) при антисептическом применении и в

ПРОИЗВОДНЫЕ 8-ОКСИХИНОЛИНА

Хинозол - местное лечение гнойных ран и язв.

Энтеросептол, Мексаформ (комбинированный препарат с Энтеросептолом),

Мексаза - лечение бактериальных дизентерий, диспепсий, связанных с бактериями.

5-НОК - лечение инфекций мочевыводящих путей (применяется редко по причине аллергий).

Нитроксалин (Nitroxolinum) 5-НОК

Применение вещества Инфекционно-воспалительные заболевания мочевыводящих путей, вызванные чувствительными микроорганизмами (в т.ч. пиелонефрит, цистит, уретрит), эпидидимит; инфицированная аденома или карцинома предстательной железы и др.); профилактика инфекционных осложнений при диагностических и лечебных вмешательствах (катетеризация, цистоскопия, после операций на почках и мочевыводящих путях).

Противопоказания Гиперчувствительность (в т.ч. к другим производным 8-оксихинолина), нарушения функции почек, сопровождающиеся олигурией, анурией; тяжелые заболевания печени, катаракта, неврит, полиневрит, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, беременность, кормление грудью.

Побочные действия вещества Диспепсия (тошнота, рвота), потеря аппетита, аллергические реакции (кожная сыпь); тахикардия, атаксия, головная боль, парестезии, полинейропатия, нарушение функции печени. При длительном применении описан случай развития неврита глазного нерва.

Способ применения и дозы Внутрь, во время еды, взрослым — по 100 мг 4 раза в сутки, максимальная суточная доза — 800 мг. Средняя доза для детей до 5 лет — по 50 мг, 5 лет и старше — по 50–100 мг 4 раза в сутки. Курс лечения — 2–3 нед. Повторные курсы (в случае необходимости) проводят с 2-недельным перерывом. При хронических рецидивирующих процессах курс лечения составляет несколько месяцев.

Для профилактики инфекций при операциях на почках и мочевыводящих путях — по 100 мг 4 раза в сутки в течение 2–3 нед.

Форма выпуска:

Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,05 г (50 мг) в упаковке по 50 штук. -

Rp.: Tab. Nitroxolini 0,05 N 50

D.S. по 2 таблетке 4 раза в сутки в течение 2-3 недель



Нитрофураны

Препараты имеют широкий спектр, действуют на грамположительные и грамотрицательные микроорганизмы, включая сальмонеллы, бруцеллы, простейшие (трихомонады, лямблии), хламидии, анаэробы.

В зависимости от концентрации оказывают бактериостатическое В зависимости от концентрации оказывают бактериостатическое или бактерицидное В зависимости от концентрации оказывают бактериостатическое или бактерицидное действие. Под влиянием нитрофуранов блокируется цикл трикарбоновых кислот в микробной клетке, тормозится клеточное дыхание, рост и размножение микроорганизмов: нарушение биосинтеза ряда мембранных белков и активности дыхательных ферментов В зависимости от концентрации оказывают бактериостатическое или бактерицидное действие. Под влиянием нитрофуранов блокируется цикл трикарбоновых кислот в микробной клетке,

Нитрофураны

Привыкание микроорганизмов к нитрофуранам почти не возникает. Препараты не подавляют иммунные свойства организма, снижают продукцию микроорганизмами токсинов; благодаря высокому содержанию в лимфе препятствуют распространению инфекции. Нитрофураны применяются местно: нитрофурал (фурацилин), фуразидин (фурагин), фуразолидон.

При кишечных инфекциях При кишечных инфекциях (дизентерия При кишечных инфекциях (дизентерия, брюшной тиф При кишечных инфекциях (дизентерия, брюшной тиф, паратифы, пищевые токсикоинфекции и др.) применяют (внутри) фуразолидон, который наиболее активен в отношении грамотрицательных бактерий, лямблий и трихомонад. Он хорошо всасывается, проникает в ткани и выделяется с желчью и секретом кишечных желез.

Нитрофурантоин (фурадонин) и фуразидин (фурагин) используют при инфекциях мочевыводящих путей, так как они быстро резорбируются и выделяются с мочой, создавая высокую концентрацию в почках. Растворимый фурагин (солафур) может применяться при генерализованных инфекциях (сепсис, раневая инфекция и др.). Для обработки порезов, ссадин, трещин часто используют фурапласт - препарат, образующий на поверхности ткани плотную эластичную пленку.

Фурадонин

Применяется внутрь для лечения инфекций мочевыводящих путей, при сепсисе, перитоните. Местно - для промывания гнойных ран.

Фурацилин

Обработка операционного поля, лечение химических и термических ожогов. Местное лечение тонзиллитов и отитов (полоскание), конъюнктивитов (глазные капли), инфекций мочевыводящих путей.

Фуразолидон

Применяется внутрь для лечения бактериальной дизентерии, сальмонеллеза, трихомониаза.



ФУРАДОНИН (*Furadoninum*)

оказывает губительное действие на большую группу микроорганизмов, но чаще всего используется для лечения инфекционных заболеваний мочевыводящих путей (пиелит, уретрит, цистит). Его используют также как профилактическое средство при проведении урологических исследований и операций

Способ применения и дозы. Применяют внутрь по 0,1 — 0,15 г 4 раза в день. Курс лечения 5—8 дней. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая — 0,3 г, суточная — 0,6 г.

Побочное действие. Возможны аллергические сыпи, потеря аппетита, тошнота, изжога, иногда рвота.

Противопоказания. Тяжелые заболевания сердца, печени и почек. Повышенная чувствительность к производным нитрофурана.

Форма выпуска. Порошок; таблетки, в упаковке 20 штук по 0,05 и 0,1 г; таблетки, растворимые в кишечнике, по 0,03 г, в упаковке 30 штук (для детей), и по 0,1 г, в упаковке 20 штук.

ФУРАЗОЛИДОН (*Furazolidonum*)



несколько отличается от фурацилина по спектру
__противомикробного действия. Он активен в отношении возбудителей
__дизентерии, брюшного тифа, паратифа, а также простейших —
__трихомонад и лямблий

Способ применения и дозы. Внутрь после еды. При дизентерии, паратифе, пищевых токсикоинфекциях по 0,1 — 0,15 г 4 раза в сутки в течение 5—10 дней. Дозы для детей уменьшают соответственно возрасту. Длительность лечения зависит от тяжести инфекции. Не рекомендуется применять препарат свыше 10 дней подряд. При лямблиозе по 0,1 г 4 раза в сутки. Детям 10 мг/кг в день (в 3—4 приема). При трихомонадных инфекциях по 0,1 г 3—4 раза в день в течение 3 дней; кроме того, в течение 7—14 дней проводят местное лечение: ежедневно вводят во влагалище 5—6 г порошка (фуразолидон и молочный сахар 1:400—1:500); per rectum суппозитории, содержащие 0,04 — 0,005 г фуразолидона. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая — 0,2 г, суточная — 0,8 г.

Побочное действие. Возможны тошнота, рвота, снижение аппетита, аллергические реакции.

Противопоказания. Повышенная чувствительность к производным нитрофурана; необходима осторожность при нарушении функции почек.

Форма выпуска. Порошок; таблетки по 0,05 г, в упаковке 20 штук; гранулы в упаковке по 50 г (для детей)

Примеры рецептов

Фурозолидон для приема внутрь ребенку 3 лет

Rp: Tab. Furazolidoni 0,05 N 20

D.S. по 1 таблетке 4 р/д (после еды)



Фурагин для приема внутрь ребенку 4 лет

Rp: Tab. Furagini 0,05

D.t.d. N 20

S. ½ таблетки 4 р/д (3-8 мг/кг/сут)

Нитроимидазолы

синтетические антимикробные препараты с высокой активностью в отношении анаэробных бактерий и возбудителей протозойных инфекций. Первый препарат группы - **метронидазол** - был разрешен для медицинского применения в 1960 г.

Показания к применению: амебиаз, трихомонадный кольпит, уретрит, лямблиоз, *Helicobacter pylori* при язве ЖКТ

Механизм действия. Нитроимидазолы оказывают избирательный бактерицидный эффект в отношении тех микроорганизмов, ферментные системы которых способны восстанавливать нитрогруппу. Активные восстановленные формы препаратов нарушают репликацию ДНК и синтез белка в микробной клетке, ингибируют тканевое дыхание.

Фармакокинетика. При приеме внутрь хорошо всасываются, биодоступность составляет более 80% и не зависит от пищи. Метронидазол хорошо всасывается при интравагинальном введении в виде таблеток. Пиковые концентрации в крови в этом случае составляют примерно 50% тех, которые достигаются при приеме эквивалентной дозы внутрь. При использовании вагинального геля абсорбция значительно ниже. При наружном применении метронидазол практически не всасывается. Нитроимидазолы распределяются во многих тканях и биологических жидкостях, хорошо проходят через ГЭБ (создавая высокие концентрации в СМЖ и в ткани мозга) и плацентарный барьер, проникают в грудное молоко, активно секретируются со слюной и желудочным соком.

Нитроимидазолы метаболизируются в печени с образованием активных и неактивных метаболитов. Медленно выводятся из организма, с мочой - 60-80% принятой дозы, примерно 20% в неизмененном виде, с калом - до 15%. При повторных введениях возможна кумуляция. Период полувыведения в зависимости от препарата составляет от 6 ч (метронидазол) до 20 ч (секнидазол); у новорожденных может возрастать. При почечной недостаточности период полувыведения нитроимидазолов не изменяется.

ТРИХОПОЛ (Trichopol)

Фармакологическое действие. Противотрихомонадное средство

Показания к применению. Острый и хронический трихомониаз у женщин и мужчин.

Способ применения и дозы. Внутрь по 0,25 г 2 раза в день в течение 7—10 дней. Иногда первые 3—4 дня назначают по 0,25 г 3 раза в день. Общая доза на курс лечения 5 г.

Побочное действие. Диспептические явления, сухость во рту, потеря аппетита; иногда лейкопения. В отдельных случаях избыточное развитие грибковой флоры влагалища, что требует одновременного назначения нистатина.

Форма выпуска. Таблетки по 0,25 г, в упаковке 20 штук.

Rp: Tab. Trichopoli 0,25

D.t.d. N20.

S. по 1 таблетке 2 р/д



Производные хиноксалина

небольшая группа синтетических противомикробных лекарственных средств - хиноксидин и диоксидин, являющихся производными хиноксалин-1,4-диоксида.

Хиноксидин и диоксидин оказывают на микроорганизмы бактерицидное действие. Механизм действия хиноксалинов обусловлен способностью препаратов вызывать глубокие структурные изменения в цитоплазме микроорганизмов и нарушать синтез бактериальной ДНК, что влечет за собой их гибель. Необходимо отметить, что активность лекарств этой группы усиливается в анаэробной среде в связи с их способностью вызывать образование активных форм кислорода.

Хиноксалины эффективны против штаммов бактерий, устойчивых к действию других химиотерапевтических лекарственных средств, но высокотоксичны, поэтому в клинической практике их используют только при тяжелых гнойно-воспалительных процессах, не поддающихся лечению другими лекарствами и только у взрослых. Терапию этой группой лекарств проводят в условиях стационара под строгим медицинским контролем, их рассматривают как противомикробные препараты «глубокого» резерва.

Диоксидин (Dioxydinum)

антибактериальный препарат из группы производных хиноксалина. Имеет широкий спектр действия, оказывая антибактериальное, бактерицидное действие на различных возбудителей – стафилококки, синегнойную палочку, патогенные анаэробы, и на некоторые на штаммы бактерий, которые устойчивы к другим антибиотикам.

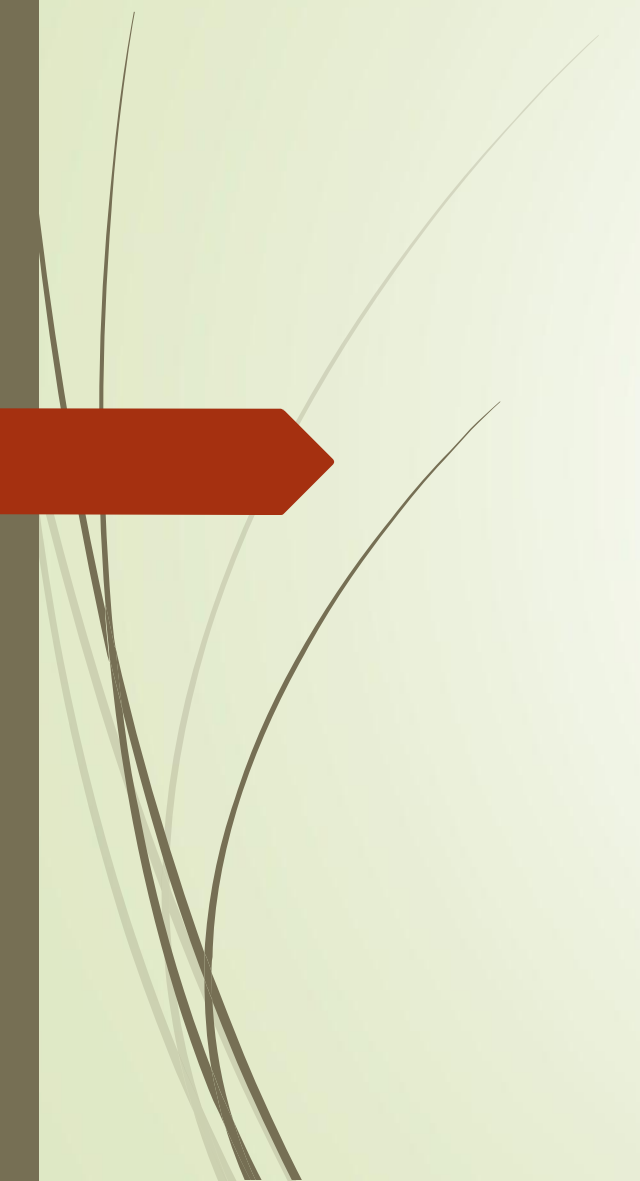
Диоксидин применяется при лечении различных гнойно-воспалительных процессов, вызванных сальмонеллами, клебсиеллой, стафилококками, вульгарным протеем, дизентерийной палочкой, синегнойной палочкой, стрептококками, патогенными анаэробами. Способствует быстрому очищению и заживлению раневых поверхностей. Также стимулирует репаративную регенерацию. Широко применяется в педиатрии при лечении ринитов различного происхождения.

Форма выпуска Препарат Диоксидин выпускают в виде раствора и мази для наружного применения. Диоксидин в ампулах 0,5 % и 1% раствора. Для местного и внутриполостного применения. По 10 мл и 20 мл в ампуле. По 10 штук в упаковке; Мазь для наружного применения 5%. В тубах по 25 мг, 30 мг, 30 мг, 50 мг, 60 мг, 100 мг.

Rp.: Ung. Dioxydini 5% - 30,0

D.S. Смазывать гнойничковые поражения кожи 2 раза в сутки.





Спасибо за внимание