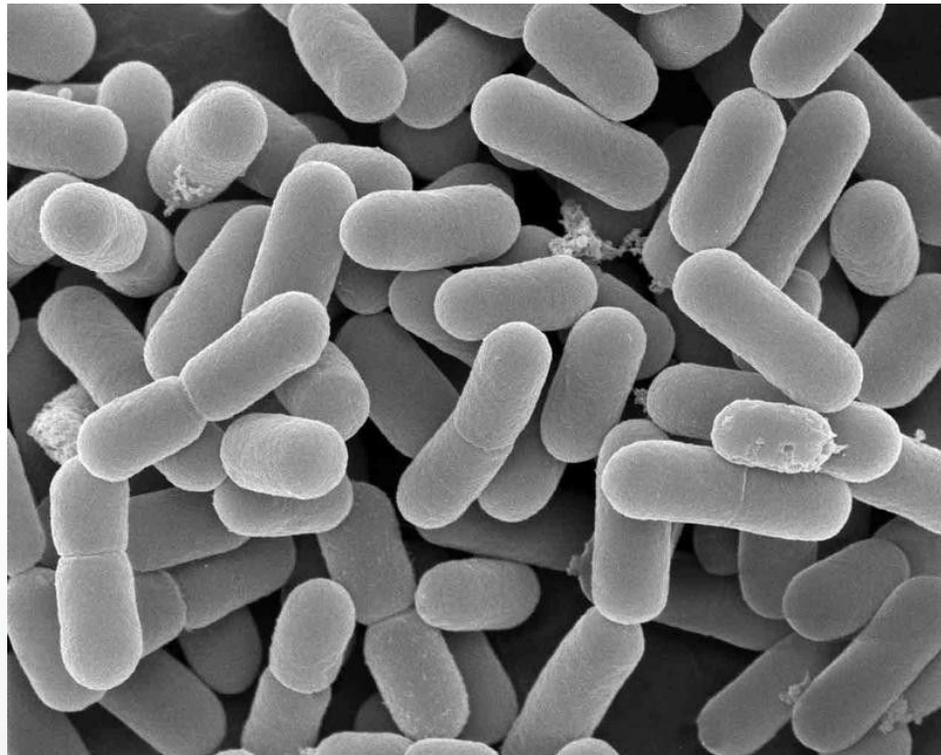


СИНТЕТИЧЕСКИЕ ПРОТИВОМИКРОБНЫЕ СРЕДСТВА



История создания.

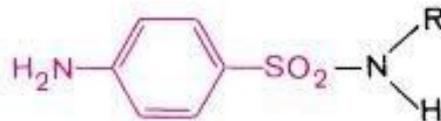
- Сульфаниламиды были первыми химиотерапевтическими антибактериальными средствами широкого спектра действия, которые нашли применение в практической медицине. Химически они являются производными сульфаниламида (амида сульфаниловой кислоты).
- Г. ДОМАГК (1895-1964). В 1935 г. открыл антибактериальные свойства пронтозила (красный стрептоцид) и внедрил его в медицинскую практику. Это был первый препарат из группы сульфаниламидных средств.



Механизм действия.

- Механизм связан с конкурентным антагонизмом с пара-аминобензойной кислотой. Она включается в структуру дигидрофолиевой кислоты, которую синтезируют многие микроорганизмы.
- В тканях человека этого не происходит, так как ткани человека используют уже готовую дигидрофолиевую кислоту. Этим и объясняется избирательность противомикробного действия сульфаниламидов.
- Благодаря химическому сходству с пара-аминобензойной кислотой сульфаниламиды препятствуют ее включению в дигидрофолиевую кислоту.

Химическая структура дигидрофолиевой кислоты



Общая структура сульфаниламидов



Пара-аминобензойная кислота



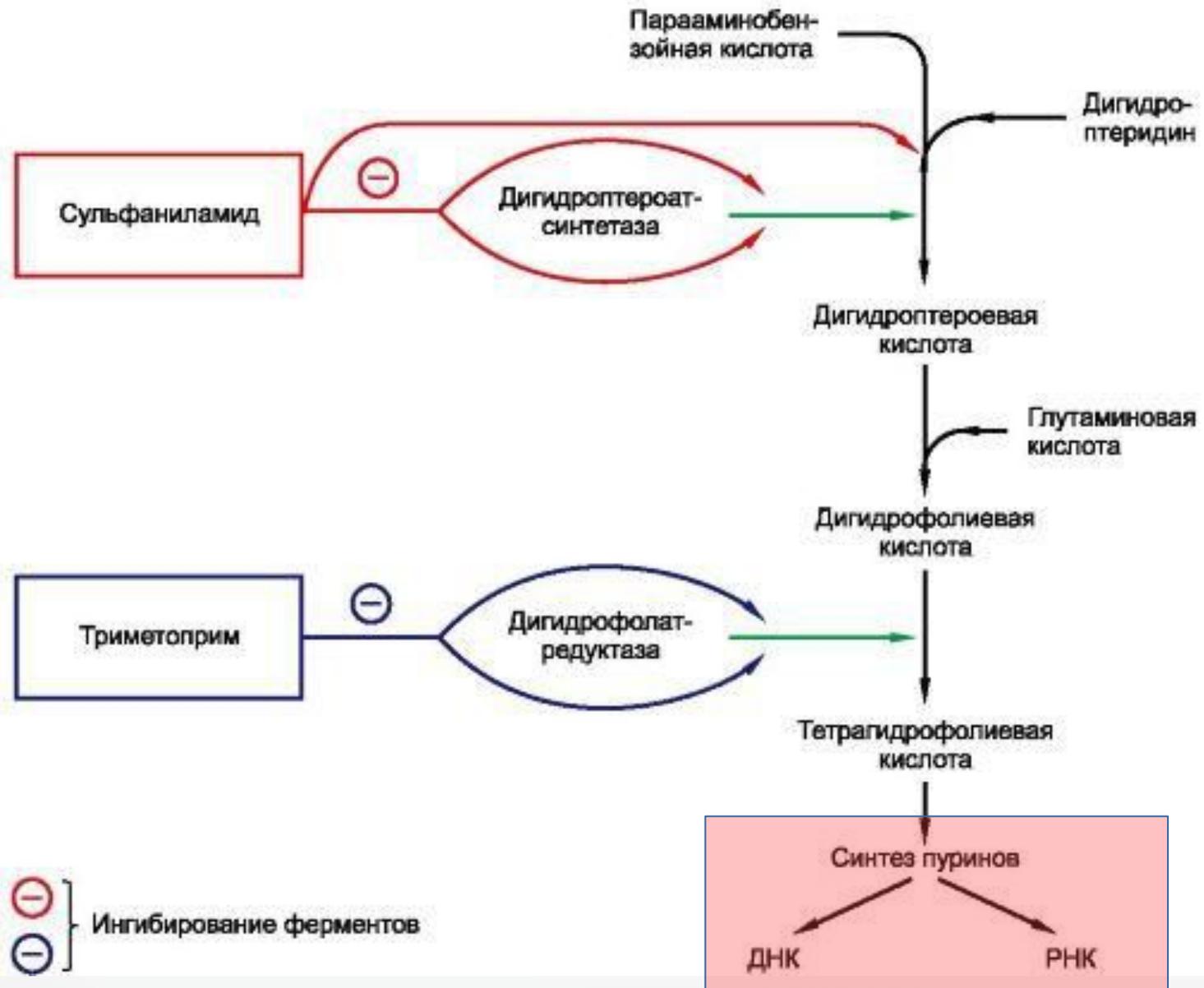
Дигидроптеридинил

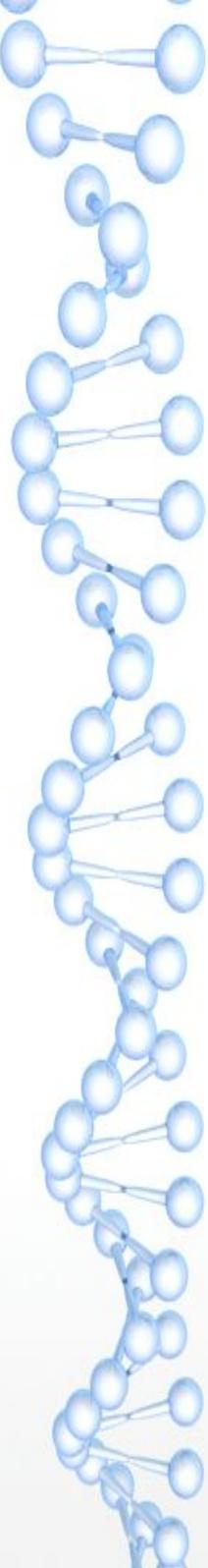
Пара-аминобензоил

Глутаминовая кислота

Дигидрофолиевая кислота

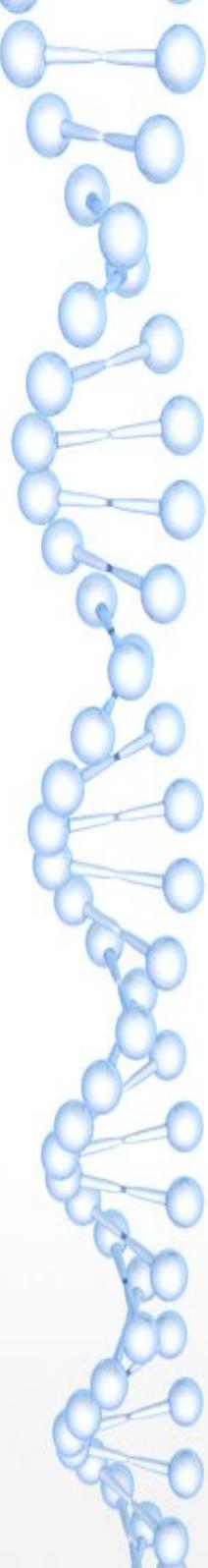
Механизм действия.





Спектр антибактериального действия.

- . Бактерии - патогенные кокки (грамположительные и грамотрицательные), кишечная палочка, возбудители дизентерии (шигеллы), холерный вибрион, возбудители газовой гангрены (клостридии), возбудители сибирской язвы, дифтерии, катаральной пневмонии, инфлюэнцы.
- . Хламидии - возбудители трахомы,



Классификация.

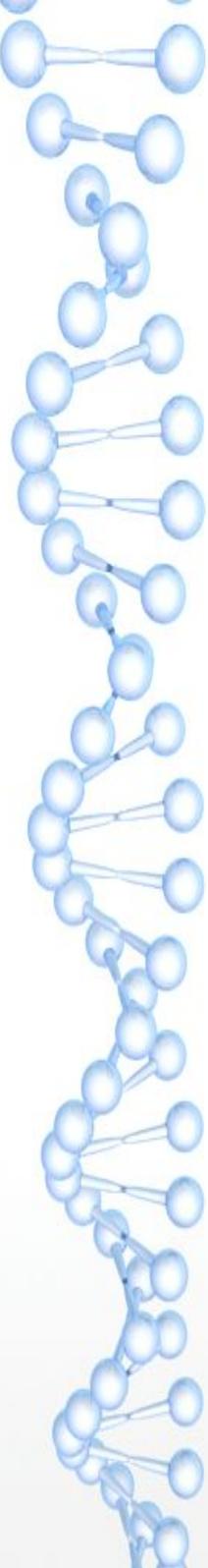
I. Препараты, применяемые для резорбтивного действия (хорошо всасывающиеся из желудочно-кишечного тракта).

А. Средней продолжительности действия (4-6 ч). Сульфадимезин, Этазол, Сульфазин, Уросульфан.

Б. Длительного действия (12-24 ч). Сульфапиридазин. Сульфадиметоксин.

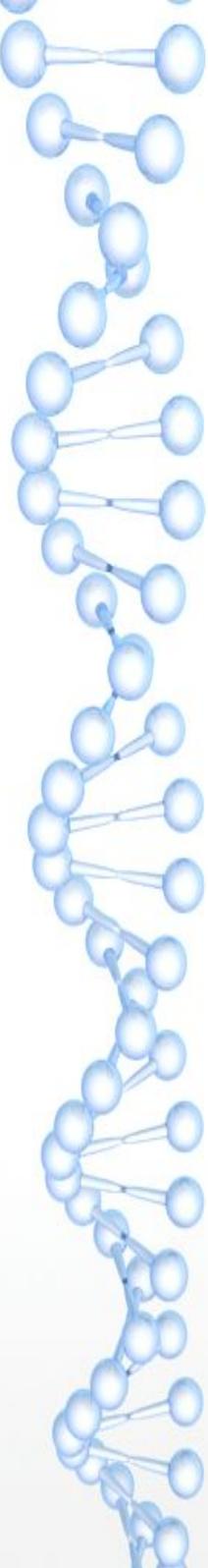
В. Сверхдлительного действия (>7 дней). Сульфален.

II. Препараты действующие в



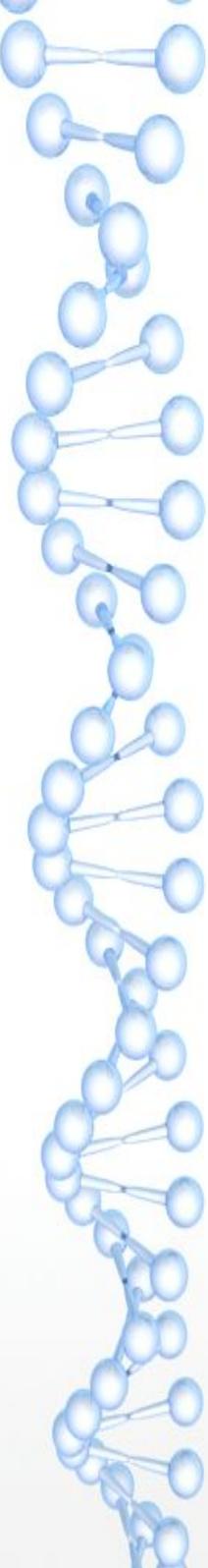
Применение сульфаниламидов.

- По противомикробной активности сульфаниламиды значительно уступают антибиотикам.
- Применяют при непереносимости антибиотиков или развитии привыкания к ним.
- Нередко сульфаниламиды комбинируют с антибиотиками.
- Сульфаниламиды для резорбтивного действия применяют при кокковых



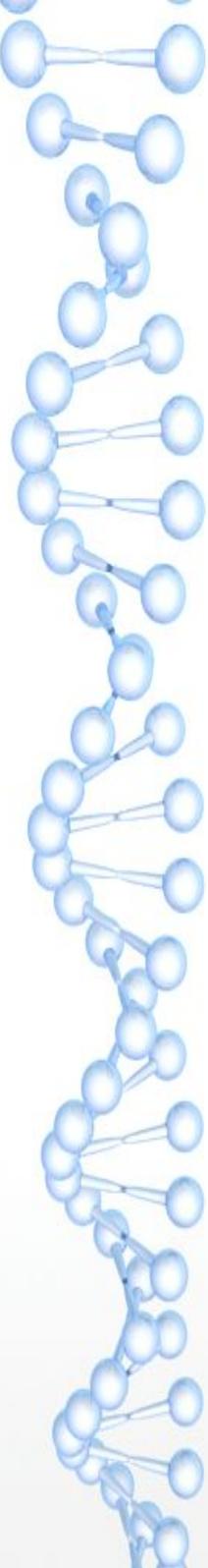
Резорбтивное действие.

- При резорбтивном действии сульфаниламиды вызывают много побочных эффектов:
 - Диспепсические явления (тошнота, рвота),
 - Головная боль, слабость, нарушения со стороны ЦНС, поражения системы крови (гемолитическая анемия, тромбоцитопения, метгемоглобинообразование)



Кишечные инфекции.

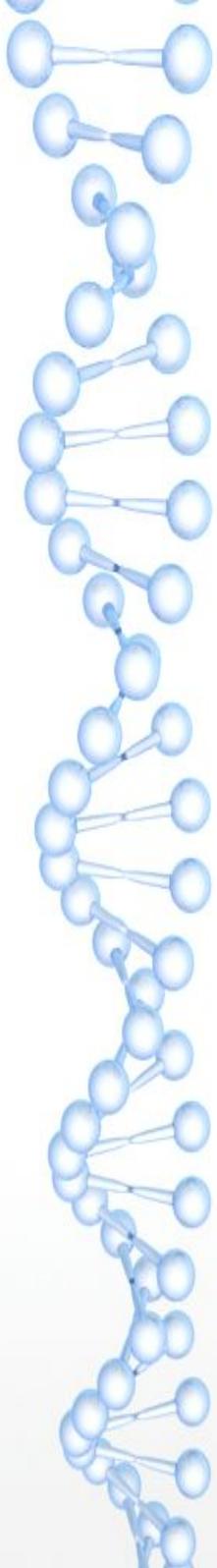
- Основным отличием препаратов группы является их плохая всасываемость из желудочно-кишечного тракта
- В просвете кишечника создаются высокие концентрации.
- Фталазол (фталилсульфатиазол). Применяют при лечении кишечных инфекций - бациллярной дизентерии, энтероколита, колита, для профилактики кишочной

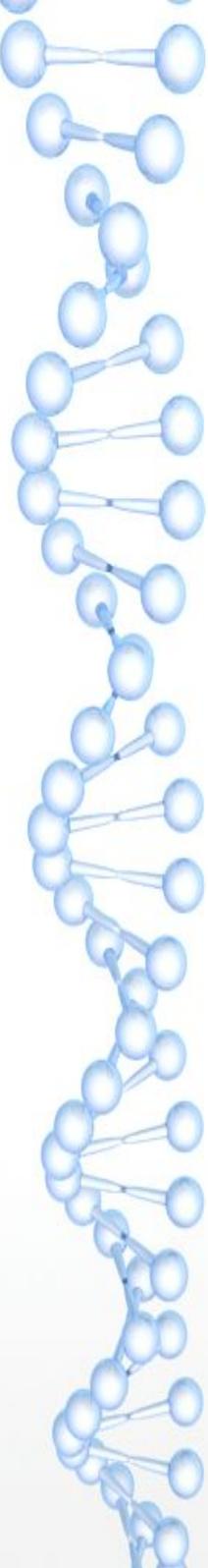


Местное применение.

- Местно сульфаниламиды применяют для лечения и профилактики инфекций глаз.
 - Сульфацил-натрий (Альбуцид).
Применяют для лечения и профилактики гонорейного поражения глаз у новорожденных и взрослых, при конъюнктивите, блефарите, язвах роговицы и др.

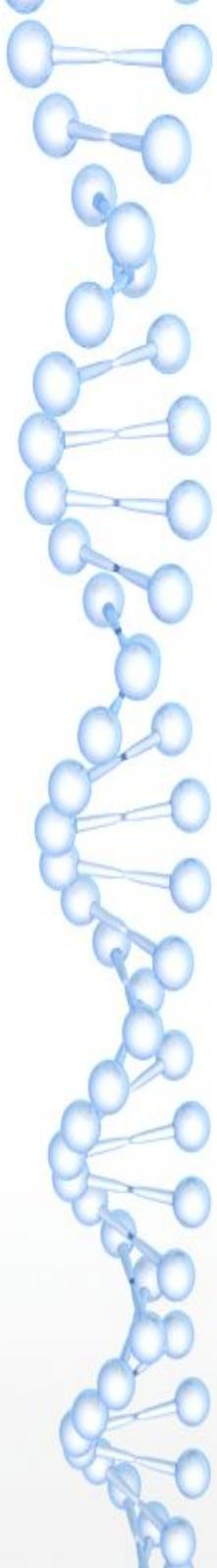
Сульфаниламиды могут быть

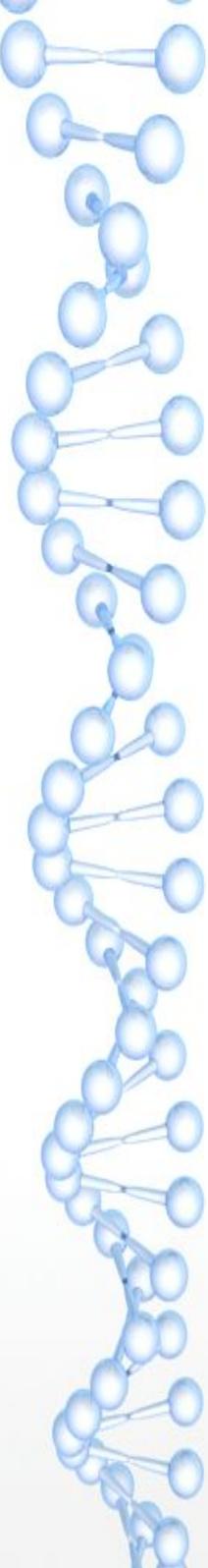




Комбинированные сульфаниламиды.

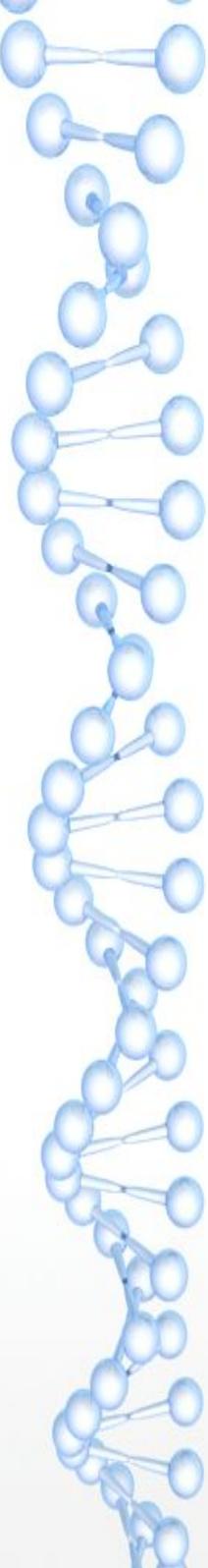
- Сочетание сульфаниамидов с препаратами, которые, угнетая дигидрофолатредуктазу, блокируют переход дигидрофолиевой кислоты в тетрагидрофолиевую. К таким веществам относится триметоприм.
- Это существенно повышает противомикробную активность - эффект становится бактерицидным. Бисептол (Бактрим). Содержит триметоприм и сульфаметоксазол.





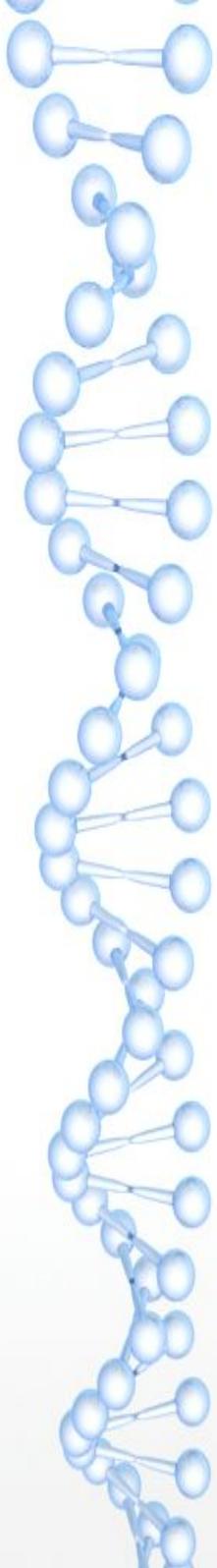
Производные хинолона.

- Первое производное хинолона - кислота налидиксовая (невиграмон, неграм). спектр действия: грамотрицательные бактерии (отсюда одно из названий - «неграм»). Она эффективна в отношении кишечной палочки, протей, капсульных бактерий (клебсиелл), шигелл, сальмонелл. Синегнойная палочка устойчива к кислоте налидиксовой.



Фторхинолоны.

- Производные хинолона, **содержащие в структуре атомы фтора**. Ципрофлоксацин (ципробай), норфлоксацин, пефлоксацин, ломефлоксацин, офлоксацин (таривид).
- Являются высокоактивными антибактериальными средствами широкого спектра действия. Оказывают бактерицидное действие на грамотрицательные бактерии, в

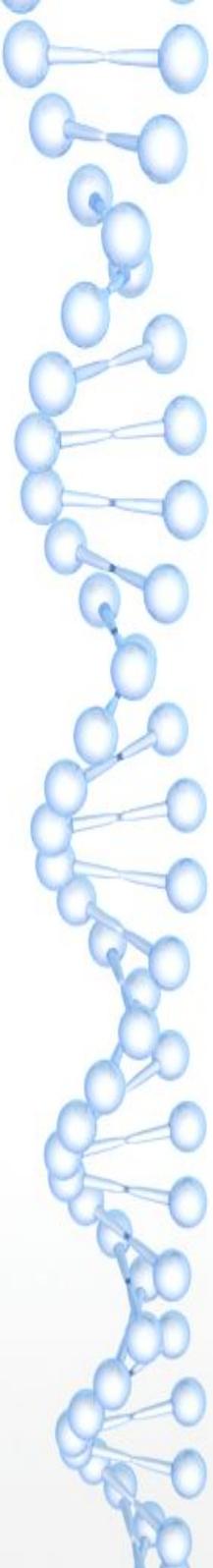


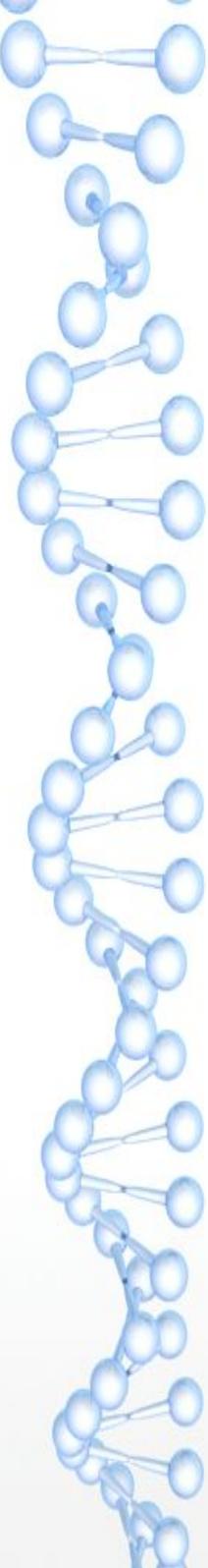
Мишени СПМС.



Фторхинолоны.

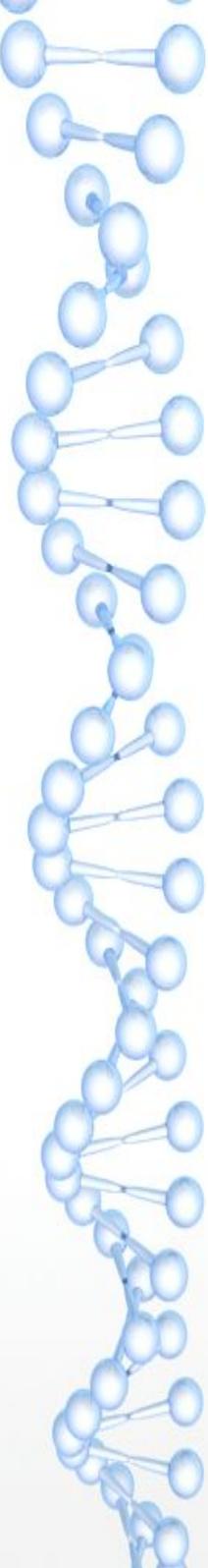
- Привыкание микроорганизмов к фторхинолонам развивается медленно. Из побочных эффектов отмечаются диспепсические нарушения, кожные высыпания и другие аллергические реакции, головная боль, головокружение, бессонница, фотосенсибилизация. Возможна суперинфекция. Редко-разрыв связок. Однако в целом фторхинолоны переносятся хорошо.





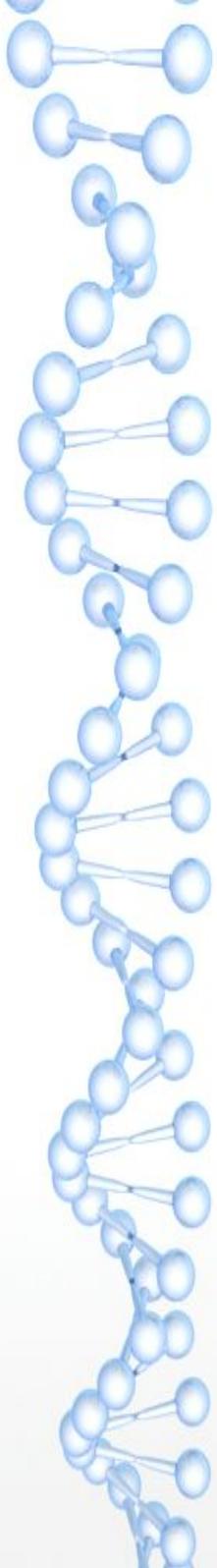
Фторхинолоны.

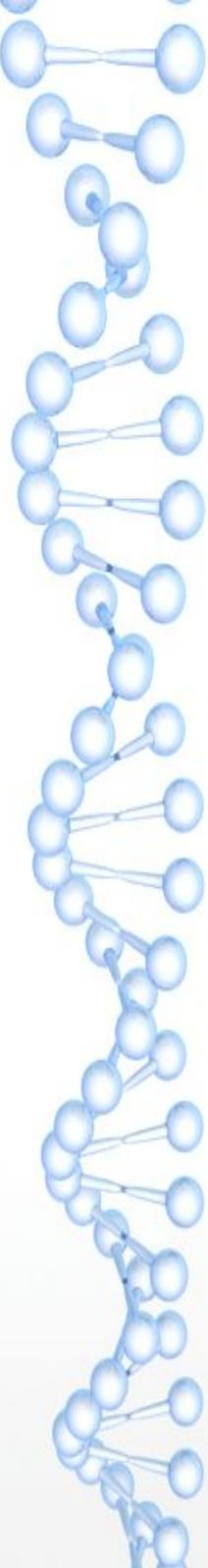
- К **новым** фторхинолонам относятся гатифлоксацин, гемифлоксацин, **левофлоксацин**. Эффективны при энтеральном введении, обладают высокой биодоступностью, характеризуются значительной эффективностью в отношении грамположительных бактерий при сохранении бактерицидного действия на грамотрицательные бактерии. Эффективны в отношении



Производные 8-оксихинолина.

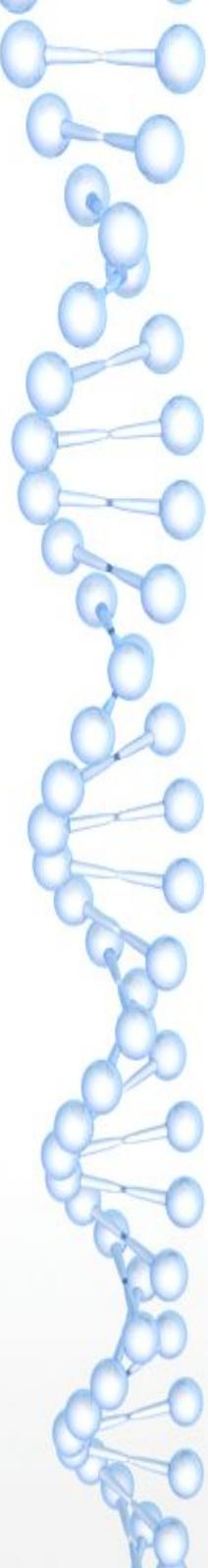
- Препараты этого ряда обладают антибактериальным и антипротозойным эффектами.
- К противомикробным средствам данной группы относится 5-нитро-8-оксихинолин - нитроксолин (5-НОК). Препарат обладает широким спектром антибактериального действия. Кроме того, он оказывает угнетающее влияние на некоторые грибы (дрожжеподобные и др.).





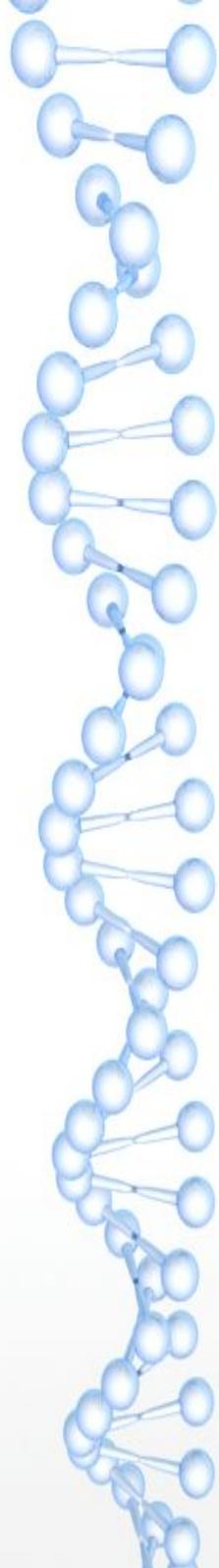
Производные нитрофурана.

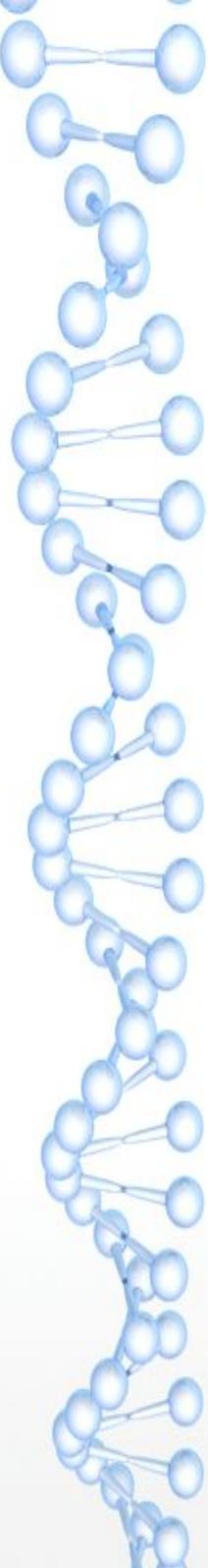
- Одни используются преимущественно в качестве антисептиков для наружного применения (например, **фурацилин**).
- Другие - для лечения инфекций кишечника и мочевыводящих путей (фуразолидон, фурадонин, фурагин).
- **Важно отметить**, что нитрофураны эффективны в отношении



Производные хиноксалина.

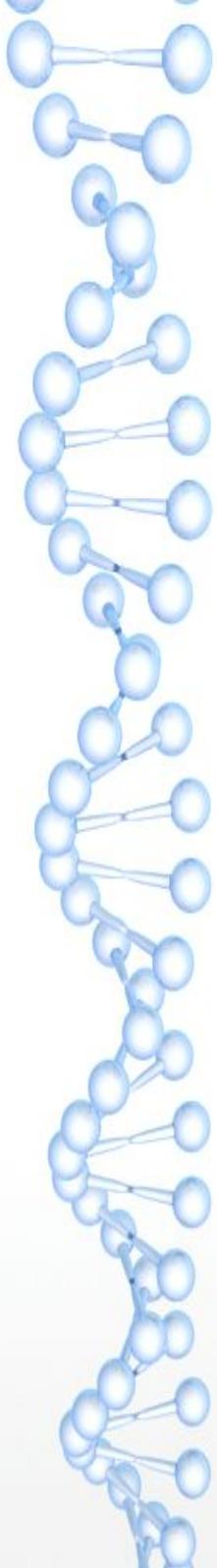
- Эта группа антибактериальных средств представлена хиноксидином и **ДИОКСИДИНОМ**.
- Обладают широким спектром противомикробного действия, включая вульгарного протeya, **синегнойную палочку**, патогенные анаэробы и др.
- Активны в отношении бактерий, устойчивых к другим антимикробным средствам



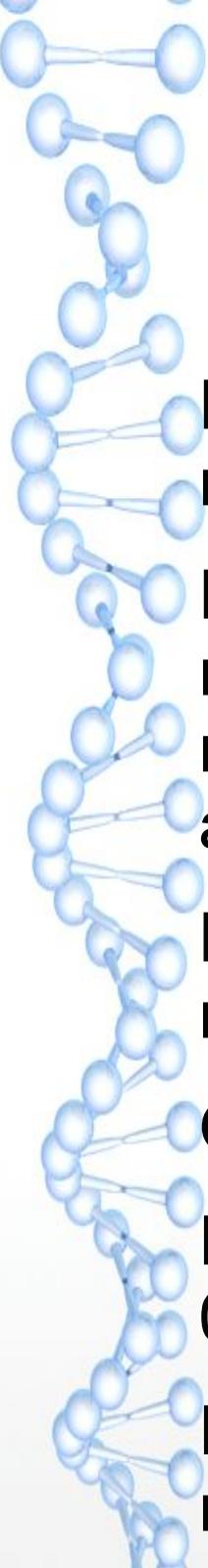


Оксазолидиноны.

- Новым классом активных противомикробных средств.
- Первый препарат этой группы линезолид (зивокс) эффективен в отношении широкого спектра возбудителей - аэробных грамположительных бактерий, некоторых грамотрицательных бактерий и многих анаэробов.
- Линезолид применяется и при инфекциях, вызванных



ЕВРОФАРМ
АПТЕКА ЕВРОПЕЙСКОГО СТАНДАРТА



Препараты.

Кислота налидиксовая - *Acidum nalidixicum*. Внутрь 0,5 г. Капсулы и таблетки по 0,5 г.

Ципрофлоксацин - *Ciprofloxacin*. Внутрь и внутривенно 0,125-0,75 г. Таблетки по 0,25; 0,5 и 0,75 г.; 0,2% раствор инфузий по 50 и 100 мл; 1% раствор в ампулах 10 мл (для разведения)

Моксифлоксацин - *Moxifloxacin*. Внутрь 0,4 г. Таблетки по 0,4 г.

Офлоксацин - *Ofloxacin*. Внутрь 0,2 г. Таблетки по 0,2 г.

Норфлоксацин - *Norfloxacin*. Внутрь 0,4 г. Таблетки по 0,4 г.

Нитроксолин - *Nitroxolinum*. Внутрь 0,1 г. Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,05 г.