



# СӨЖ

Орындаған: Әділхан Н.Т.

238-топ ,ЖМФ

Тексерген: Ожмұхаметова Э.К.

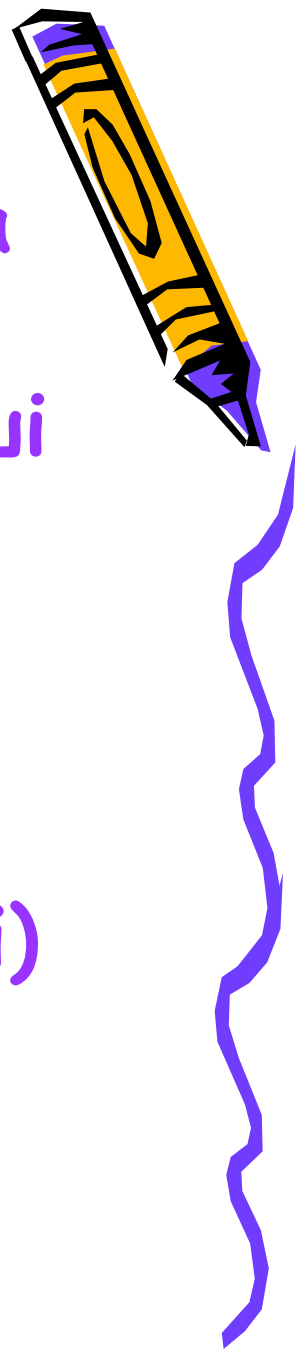
*Семей 2012*

18 1 2006



**СУЛЬФАНИЛАМИДТІК  
ПРЕПАРАТТАР**

Сульфаниламидтер медицина практикасында қолдануда орын алған әсер спектрі кең ең бірінші химиотерапиялық антибактериалды заттар. Олар химиялық құрылысы бойынша сульфаниламидтер туындысына (сульфанил қышқылының амиді) жатады.

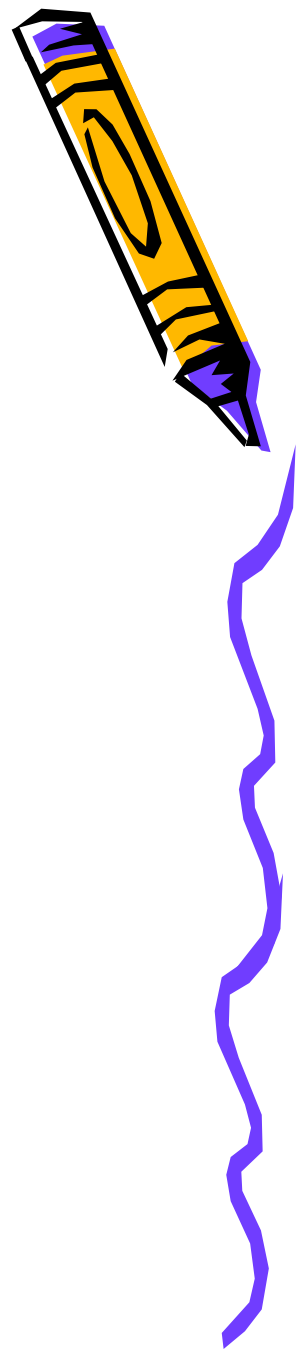




- Өте тиімді, ұзақ уақыт әсер ететін және уыттығы аз сульфаниламидтерді алу амид тобындағы сутек атомының орнын ауыстыруға негізделген. Микробтарға қарсы әсер көрсету үшін міндетті түрде пара-жағдайында бос амин тобы болуы керек. Осыған байланысты жағдайдағы сутек атомдарының орнын сирек ауыстырады; бұл ағзада радикал үзіліп, амин тобы босап шығатын жағдайда ауыстырылады. Бензол цикліне қосымша радикалдарды енгізгенде қосылыстың белсенділігі төмендейді.



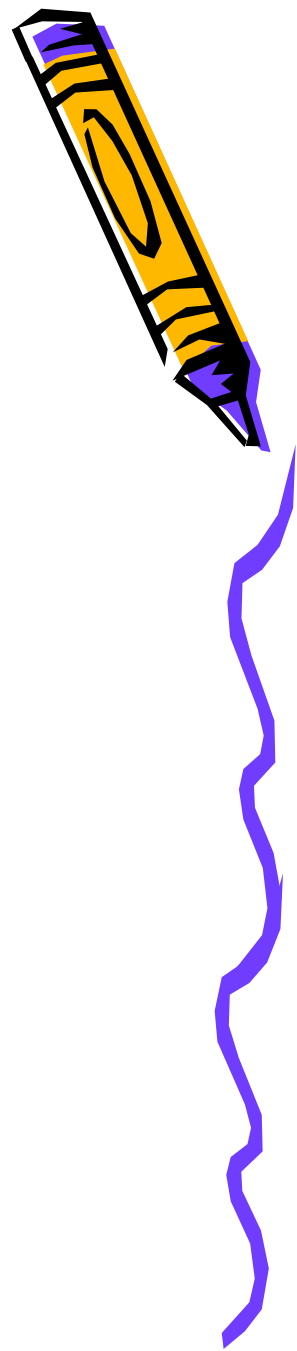
Ішек қуысына әсер  
ететін препараттар  
(асқазан-ішек  
жолдарынан нашар  
сіңетіндер)



- Фталазол



# Жергілікті қолдануға арналған препараттар



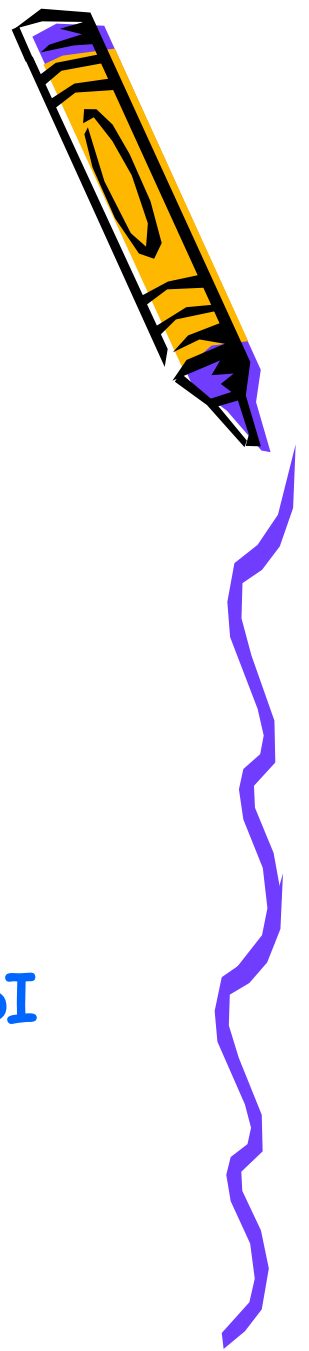
- Сульфацил - натрий
- Сульфазиннің күміс тұзы





- Сульфаниламидтердің әсер ету спектрі айтарлықтай кең. Оған негізінен келесі инфекция қоздырғыштары жатады:

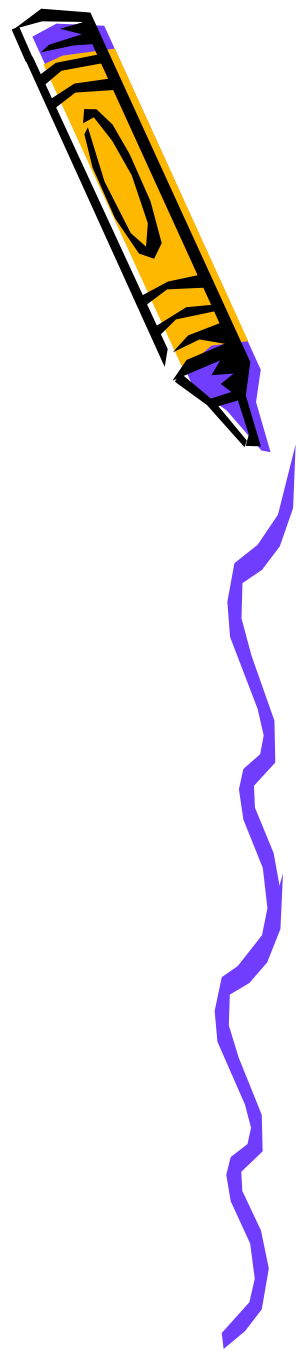




- а) бактерияларға- патогенді кокктар (грам оң және грам теріс), ішек таяқшасы, дизентерия қоздырғыштары (шигеллалар), тырысқақ вибрионы, газды гангрена қоздырғышы (клостридия), күйдіргі, дифтерия, катаралды пневмония, инфлюэнция қоздырғыштары.







- б)хламидияларға- трахома, орнитоз, шап лимфогранулемасы. в) актиномицеттер;
- г)қарапайымдылар- токсоплазмоз қоздырғышы, безгек плазмодиі



- Сульфаниламидтердің микробтарға қарсы әсер ету механизмі олардың пара-аминобензой қышқылымен бәсекелес антагонизміне байланысты. Ал, пара-аминобензой қышқылы көптеген микроорганизмдер синтездейтін дигидрофолий қышқылының құрылысына кіреді. Адам тіндерінде мұндай болмайды, себебі бұл тіндер тек дайын дигидрофолий қышқылын жұмсайды, сульфаниламидтердің микроорганизмдерге қарсы таңдап әсер етуі де осымен түсіндіріледі.





- Сульфаниламидтердің химиялық құрылысы пара-аминобензой қышқылына ұқсас болғандықтан оның дигидрофолий қышқылына айналуын тоқтатады. Сонымен қатар олар дигидроптероатсинтетаза ферментін бәсекелес тежейді. Дигидрофолий қышқылы синтезінің бұзылуынан тетрагидрофолий қышқылының синтезделуі азаяды, бұл пуриндік және пиримидиндік негіздердің синтезі үшін қажет. Нәтижесінде нуклеин қышқылының синтезі тежеледі, осының салдарынан микроорганизмдердің өсуі және көбеюі тоқтайды (бактериостатикалық әсер).





- Сульфаниламидтерді ұзақ қолданғанда оларға біртіндеп микроорганизмдердің тұрақтылығы дамиды. Бұл микроорганизмдермен дигидрофолий кышқылы синтезінің қарқынды жоғарылауына байланысты болуы мүмкін деген болжамдар айтылуда. Барлық сульфаниламидтерге тұрақтылық (демек, қиылысқан тұрақтылық) дамитынын ескеру керек.



# РЕЗОРБИВТІ ӘСЕРГЕ АРНАЛҒАН СУЛЬФАНИЛАМИДТЕР



- Бұл топтың препараттары асқазан-ішек жолдарынан тез және толық сіңеді. Сульфаниламидтер сарысу альбуминдерімен жартылай байланысады. Барлық тіндерге таралады, соның ішінде гематоэнцефалдық, плацентарлық тосқауыл арқылы өтеді, дененің сероздық қуыстарында жиналады.





- Ағзада сульфаниламидтердің басқа затқа айналуының негізгі жолы — ацетилдену ( $M^*$  бойынша), ол бауырда жүреді. Бұл кезде түзілген қосылыс антибактериалдық белсенділігінен айырылған. Кейбір ацетилденген туындылар бастапқы сульфаниламидтерге қарағанда нашар ериді және зәрде кристалдардың (кристаллурияның) түзілуінің себебі болуы мүмкін. Әртүрлі препараттардың ацетилдену дәрежесі бірдей емес. Ең аз ацетилденетін уросульфан, сульфацил-натрий, этазол.





- Сульфаниламидтер және олардың метаболиттері негізінен бүйректен сүзілу жолымен бөлінеді. Сульфаниламидтердің кейбір бөлігі реабсорбцияға ұшырайды. Дәрілік заттардың аз мөлшері ішек арқылы, тер және сілекей бездерімен шығады.

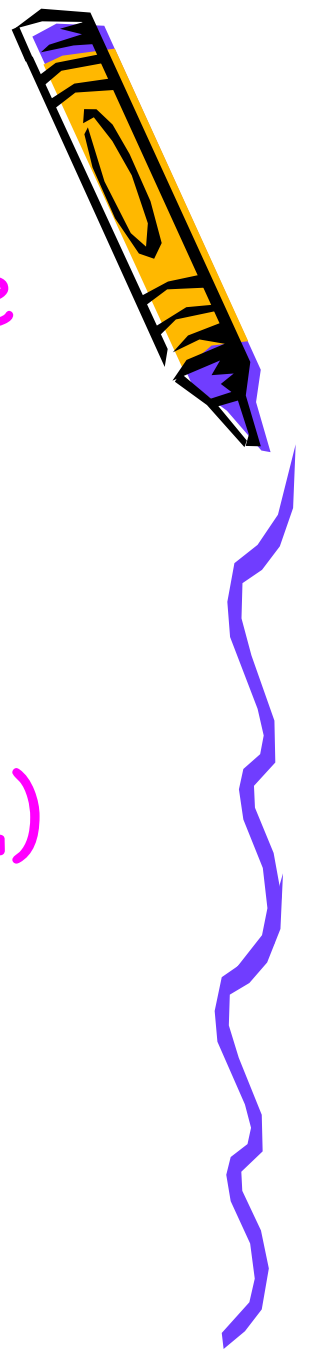




- Резорбтивті әсер етуге тағайындалған сульфаниламидтер, көбіне бактерияға қарсы әсер ету ұзақтығы бойынша бөлінеді. Ұзақ емес әсер ететін препараттар жақсы сіңеді және тез бөлінеді. Оларды энтералды енгізгенде, сарысуда жоғарғы концентрациясы 2-3 сағ кейін түзіледі. Бактериостатикалық концентрациясын қалыпты ұстап тұру үшін, оларды 4-6 сағ сайын тағайындайды.







- Ұзақ емес әсер ететін сульфаниламидтерден көбіне сульфадимезин (сульфаметазин), э т а з о л (сульфаэтилтиадиазол), сульфазин (сульфадиазин), уросульфран (сульфакарбамид) жиі қолданылады.

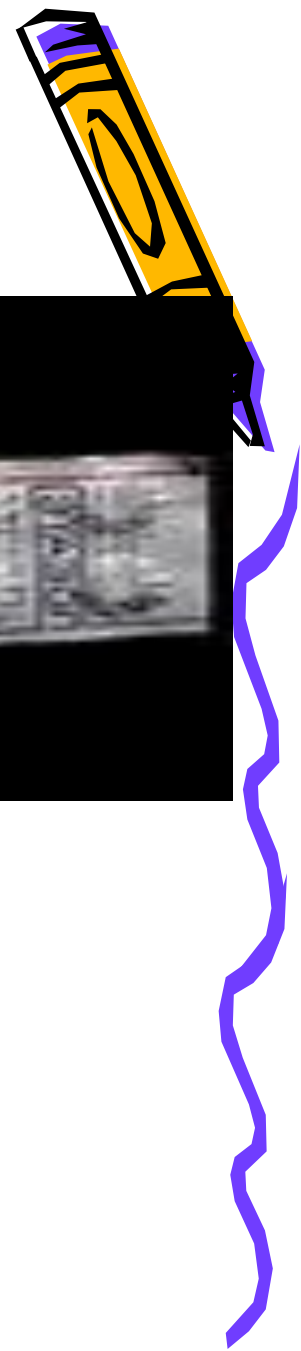




Сульфадимезин



э т а з о л





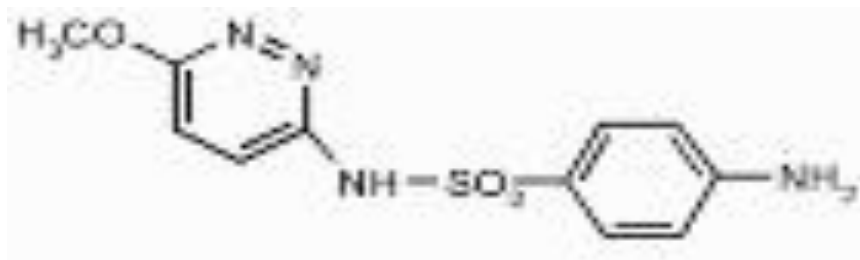
Бұл топқа стрептоцид те (ак  
стрептоцид,  
сульфаниламид) жатады.  
Бірақ стрептоцидті қазіргі  
кезде онша қолданбайды,  
себебі оның белсенділігі аз  
және басқа  
сульфаниламидтерге  
қарағанда жиі жанама  
әсерлер шақырады.





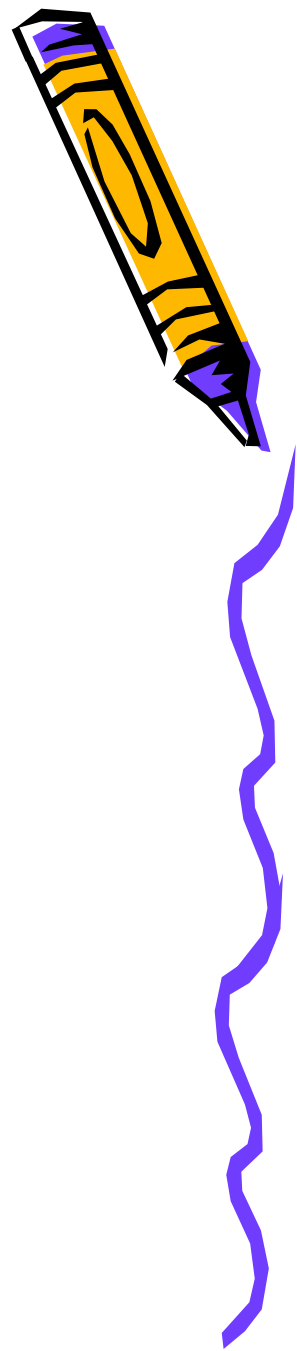
- Ұзақ уақыт әсер ететін препараттарға сульфапиридазин (сульфаметоксипиридазин, спорадазин) және сульфадиметоксин (мадрибон, мадроксин) жатады. Олар асқазан - ішек жолдарынан жақсы сіңеді, бірақ баяу шығады.





сульфапиридазин





- Қан сарысуында олардың жоғарғы концентрациясы 3-6 сағ кейін анықталады. Ағзада препараттардың бактериостатикалық концентрациясының ұзақ уақыт бойы сақталуы олардың бүйректе тиімді реабсорбциялануына тәуелді болуы керек. Сондай-ақ қан сарысуы белоктарымен айқын байланысу дәрежесінің де маңызы болуы мүмкін (мысалы, сульфапиридазин үшін ол шамамен 85% сай).





- Сонымен, ұзақ әсер ететін препараттарды қолданғанда, ағзада дәрілік заттардың тұрақты концентрациясы түзіледі. Бұл антибактериялы кем кезінде препараттардың артықшылығы болып табылады. Бірақ егер жанама әсерлер пайда болса онда ұзақ әсерлер жағымсыз рөл атқарады, себебі дәріні беруді амалсыз тоқтатқанда оның әсерінің тоқтауына бірнеше күн болады.





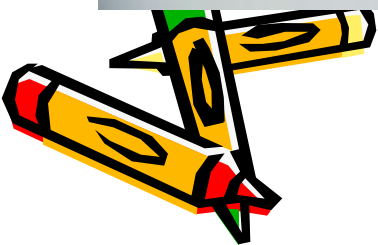
- Сондай-ақ жұлын-ми сұйықтығында сульфапиридазин мен сульфадиметоксиннің концентрациясы аз кездесетінін (қан сарысуындағы концентрациядан 5-10%) ескеру керек. Олар осы көрініспен ұзақ емес әсер ететін сульфаниламидтерден ерекшеленеді, бұл препараттар жұлын сұйықтығында барынша кеп концентрацияда (сарысу концентрациясының 50-80%) жиналады.
- Сульфапиридазин мен сульфадиметоксин тәулігіне 1-2 рет тағайындалады.

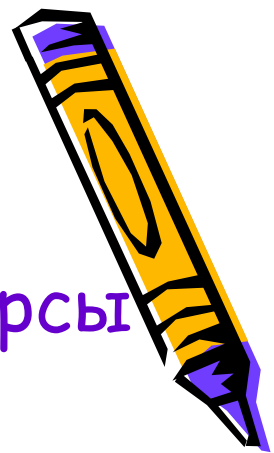






- Сульфален (келфризин, сульфаметоксипиридазин) өте ұзақ уақыт әсер ететін препарат болып табылады, ағзада оның бактериостатикалық концентрациясы 1 аптаға дейін сақталады.





- Сульфаниламидтердің микробтарға қарсы белсенділігі антибиотиктерден анағұрлым төмен, сондықтан оларды қолдану өрісі шектелген. Оларды негізінен антибиотиктер жағымсыз болғанда немесе оларға бейімделу дамығанда тағайындайды. Сульфаниламидтерді кейбір антибиотиктермен жиі жұптастырады.





- Резорбтивті әсер ететін сульфаниламидтер кокктармен шақырылған инфекцияларда, әсіресе менингококктық менингитте, тыныс алу мүшелерінің ауруларында, зәр шығару жолдары мен өт жолдарының және т.б. инфекцияларында қолданылады.





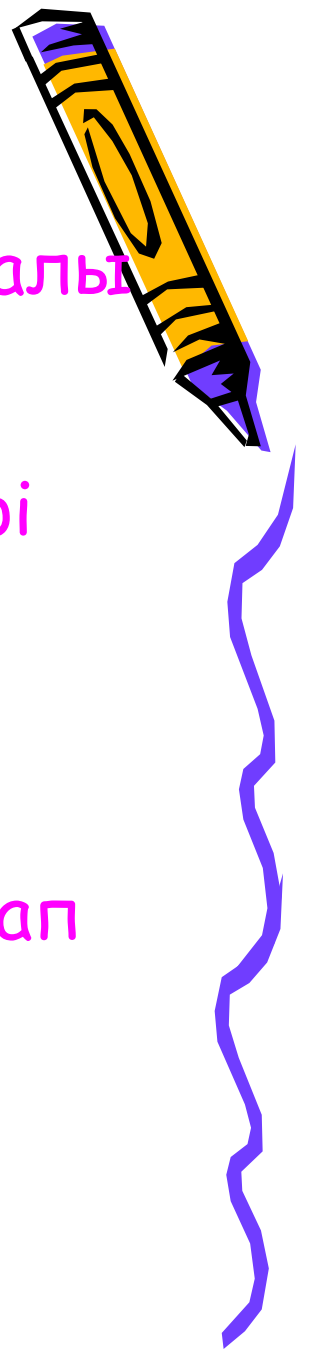
- Зәр шығару жолдарының инфекцияларын (пиелонефритте, пиелитте, циститте) емдеу үшін, әсіресе уросульфан көрсетіледі, ол көбіне өзгермеген түрде (яғни, белсенді түрде), жылдам бүйрек арқылы шығады, бұл кезде несепте оның жоғарғы концентрациясы түзіледі. Уросульфан бүйрек қызметіне теріс әсер көрсетпейді.





- Ұзақ әсер ететін препараттарды көбінесе созылмалы инфекцияларда және инфекциялардың алдын алу үшін (мысалы, операциядан кейінгі кезеңде) қолданған жөн.
- Сульфаниламидтер резорбтивті әсер еткенде көптеген жанама әсерлер шақырады. Оларды қолданғанда-диспепсиялық құбылыстар (лоқсу, құсу, бастың ауыруы, әлсіздік, орталық жүйке жүйесі бұзылыстары), қан жүйесінің бұзылуы (гемолитикалық анемия, тромбоцитопения, метгемоглобин түзілу) мүмкін, кристаллурия болуы мүмкін. Бүйректе кристалдардың тұнбаға түсу мүмкіндігін азайту үшін көп, әсіресе сілтілік сұйықтар (себебі қышқыл орта сульфаниламидтердің және олардың ацетилденген туындыларының тұнбаға түсуіне ықпал жасайды) енгізу арқылы жүзеге асыруға болады.





- Аллергиялық реакциялар салыстырмалы түрде сирек кездеседі, дегенмен олар кейде пайда болады және оның айқындығы әртүрлі болуы мүмкін. Тері бөртпесі, қызба, кейде гепатит, агранулоцитоз, апластикалық анемия байқалады. Анамнезінде сульфаниламидтерге аллергиялық реакциялардың болуы оларды қайталап қолданудың қарсы көрсеткіші болып табылады.



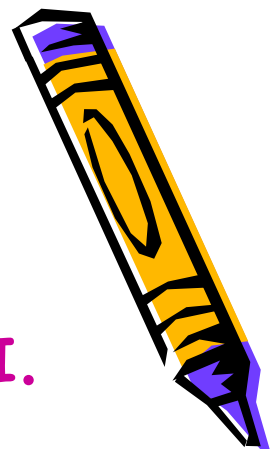
# ІШЕК ҚУЫСЫНДА ӘСЕР ЕТЕТІН СУЛЬФАНИЛАМИДТЕР



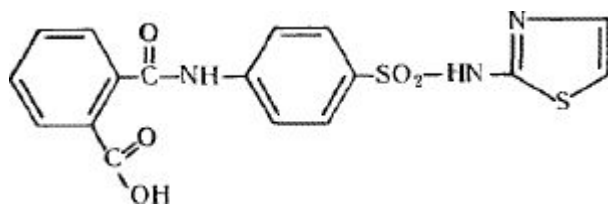
- Бұл препараттардың негізгі ерекшелігі олардың асқазан-ішек жолдарында нашар сіңгіштігі болып табылады, сондықтан ішек қуысында олардың жоғарғы концентрациясы түзіледі.



- Көбінесе фталазол (фталилсульфатиазол, талисульфазол) жиі қолданылады. Ішектен препараттың аз дәрежесі сінеді. Зәрде енгізілген препараттың 5% табылады. Фталазолдың микробтарға қарсы әсері (1М4) фталь қышқылы үзіліп және амин тобы босап шыққаннан кейін дамиды. Нәтижесінде осы кезде босап шыққан норсульфазол әсер етеді.







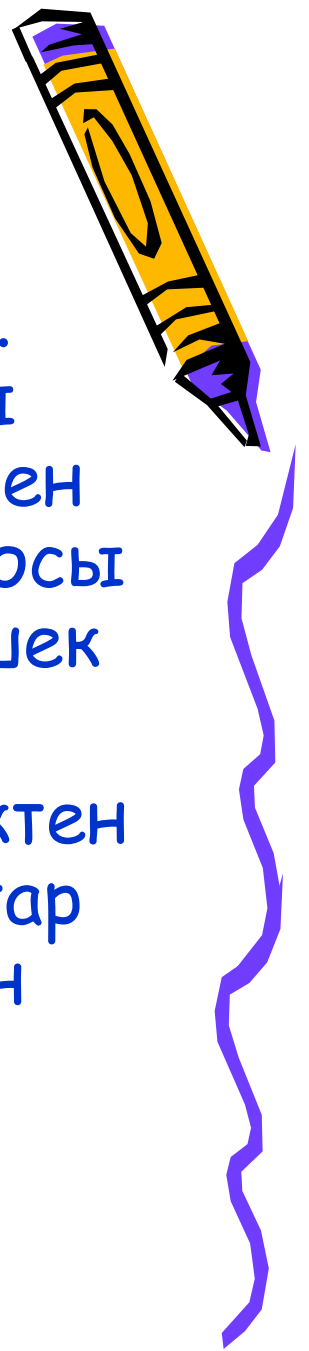
фталазол





- Фталазол ішек инфекцияларын - бациллярлы дизентерия, энтероколит, колитті емдеуде, операциядан кейінгі кезеңдегі ішек инфекциясының алдын алу үшін қолданылады. Бұл аурулар кезінде микроорганизмдер тек ішек қуысында ғана емес, сонымен қатар ішек қабырғасында да орналасатынын ескере отырып, фталазолды ішектен жақсы сіңетін сульфаниламидтермен (сульфадимезинмен, этазолмен және т. б.) жұптастырып қолданған дұрыс.
- Фталазол антибиотиктермен (мысалы, тетрациклинмен) жиі жұптастырылады.





- Оны 4-6 сағ сайын қолданады. Фталазолды наукастар жақсы көтереді. Оның уыттығы өте төмен. Фталазолды қолданғанда В тобының витаминдерімен жұптастырған жөн. Өйткені фталазол осы витаминдердің синтезіне қатысатын ішек таяқшаларының өсіп көбеюін тежейді.
- Ішек инфекцияларын емдеу үшін ішектен нашар сіңетін басқа бірқатар препараттар -сульгин (сульфагуанидин), ф т а з и н пайдаланылады.



# ЖЕРГІЛІКТІ ҚОЛДАНУҒА АРНАЛҒАН СУЛЬФАНИЛАМИДТЕР



- Көз инфекцияларын емдеу және алдын алу үшін сульфаниламидтер жергілікті қолданылады. Осы мақсатпен суда еритін сульфацил-натрий бәрінен жиі қолданылады. Ол барынша тиімді және тітіркендіргіш әсер көрсетпейді. Оны жаңадан туылған нәрестелер мен ересек адамдардың көз\_қоздырғышымен жұқтырылған көз ауруларын емдеу және алдын алу үшін конъюнктивитте, блефаритте, қасаң қабаттың ойық жарасында және т.б. қолданады.







- Сульфаниламидтер жұқпалы жараларда (әдетте, жараны опалау жолымен) пайдаланылуы мүмкін. Бұл кезде жара бөліндісі, ірің, некроз массасы болғанда, сульфаниламидтер аз немесе мүлдем әсер етпейтінін ескеру керек, себебі олардың құрамында пара-аминобензой қышқылы өте көп болады. Оларды жараны біріншілік өндегеннен кейін ғана немесе "таза" жара жағдайында қолдану керек.





- Молекуласында күмістің атомы бар сульфазиннің күміс тұзы (сульфаргин) синтезделген. Препаратты күйік жарасында тек жергілікті қолданады. Препараттан босап шығатын күміс сульфазинінің микробтарға қарсы әсерін күшейтеді және жараның жазылуына әкеледі. «Сульфаргин» жағылмасының құрамына кіреді.



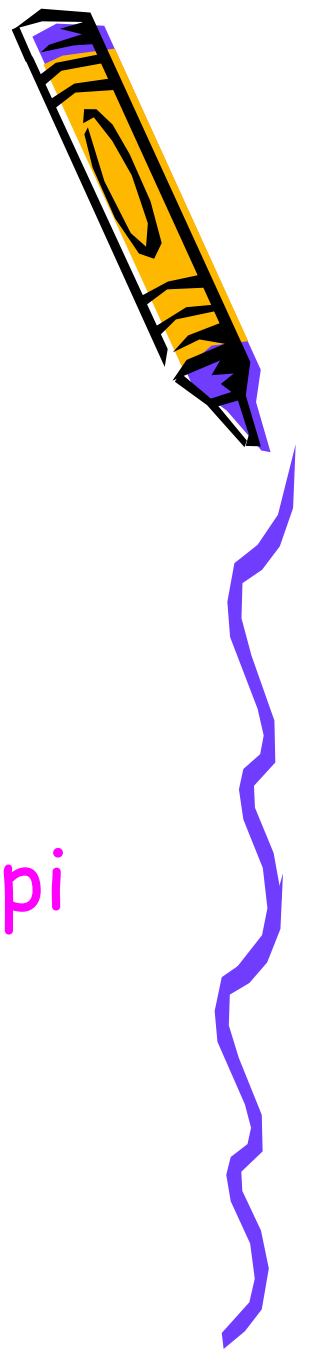
# СУЛЬФАНИЛАМИДТЕРДІҢ ТРИМЕТОПРИММЕН ЖҰПТАСТЫРЫЛҒАН ПРЕПАРАТТАРЫ



- Сульфаниламидтермен жұптасқан препараттар қызығушылық тудырады, олар дигидрофолатредуктазаны тежеп, дигидрофолийдің тетрагидрофолий қышқылына өтуін тоқтататындар. Мұндай заттарға триметоприм жатады.







- Екі түрлі кезеңдерде көрінетін нуклеин қышқылы прекурсорларының биосинтезіне осы сияқты жұптасқандардың тежегіш әсерлері олардың микробтарға қарсы белсенділігін айтарлықтай жоғарылатады - әсері бактерицидтік болады.



- Сульфаметаксазол мен триметопримен тұратын б а к т р и м (бисептол, котримоксазол, септрин) препараты шығарылады. Оның бактерияға қарсы жоғарғы әсері бар. Бактерицидтік әсер көрсетеді. Асқазан-ішек жолдарынан жақсы сіңеді. Қан сарысуында препараттың жоғарғы концентрациясы 3 сағ кейін анықталады. Әсер ету ұзақтығы 6-8 сағ. Бактримнің екі компоненті де негізінен бүйрек арқылы шығады. Бактримді қолданғанда әртүрлі жанама әсерлер байқалады. Диспепсиялық бұзылыстар (лоқсу, құсу, анорексия, диарея) және тері жағынан аллергиялық реакциялар (эритематоздық бөртпелер, есек жем, қышыну) көбінесе жиі болады.



- Қан түзетін жүйені тежеуі (лейкопения, агранулоцитоз, тромбоцитопения, мегалобластық анемия және т.б.) мүмкін. Кейде бауыр және бүйрек қызметтерінің бұзылуы дамиды. Суперинфекция (ауыз қуысының кандидамикозы) да дамуы мүмкін. Бактримді ұзақ уақыт қолданғанда шеткі қанның құрамын бақылап отыру керек.
- Бактрим бауыр, бүйрек және қан түзу жүйесі айқын бұзылғанда қолданылмайды. 6 жасқа дейінгі балаларға және жүктілік кезінде оны тағайындаудың қажеті жоқ.



- Лидаприм (сульфаметрол + триметоприм), сульфатон (сульфамонометоксин триметоприммен), сонымен қатар потесептил (сульфадимезин + триметоприм) осыған ұқсас препараттар болып табылады. Барлық препарат үшін қолдану көрсеткіштері, жанама әсерлері және қолдануға қарсы көрсеткіштері бактримдегідей.

