

Стрептоміцин



Стрептомицин

- Саудалық атауы

- Стрептомицин

- Дәрілік түрі

- Бұлшықет ішіне енгізу үшін ерітінді дайындауға арналған 1г ұнтақ

- Құрамы

- Бір құтының ішінде

- белсенді зат — стрептомицин сульфаты

- (стрептомицинге шаққанда) — 1,0г

- Сипаттамасы

- Ақ немесе ақ дерлік ұнтақ. Гигроскопиялы.

Фармакотерапиялық тобы

Бактерияларға қарсы жүйелік пайдалануға арналған препараттар. Бактерияларға қарсы аминогликозидті препараттар.

Фармакологиялық қасиеттері

Фармакокинетикасы

- Бұлшықет ішіне (б/і) енгізген кезде инъекция жасалған жерден стрептомицин тез және толық сіңеді. Қан плазмасында ең жоғары концентрацияға жету уақыты – 0.5-1.5 сағ., 1г б/і енгізгеннен кейін қан плазмасындағы ең жоғары концентрациясы – 25-50 мкг/мл. Плазма ақуыздарымен байланысуы – 10%-дан аз.

• Стрептомицин

- организмнің барлық тіндеріне (ми тіндерінен басқа), соның ішінде жасушадан тыс сұйықтыққа, абсцесс сұйықтығына, перикардальді, синовиальді, лимфатикалық және перитонеальді сұйықтарға таралады.
- Бүйректе, бауырда, өкпеде жоғары концентрацияларда болады; төмен концентрацияларда – сүйек және май тіндерінде.
- Таралу көлемі ересектерде – 0.26 л/кг, балаларда – 0.2-0.4 л/кг, туғанына 1 апта толмаған және дене салмағы 1500 г-нан аз нәрестелерде – 0.68 л/кг дейін, жасы 1 аптаға толмаған және дене салмағы 1500 г-нан асатын нәрестелерде – 0.58 л/кг дейін, муковисцидозы бар науқастарда – 0.3-0.39 л/кг. Зақымданбаған ГЭБ арқылы өтпейді. Плацента арқылы және емшек сүтіне өтеді. Метаболизмге ұшырамайды.

- Препараттың жартылай шығарылу кезеңі ересектерде – 2-4 сағат, жаңа туған нәрестелерде – 5-8 сағат, жасы үлкендеу балаларда – 2.5-4 сағат.
- Ақырғы $T_{1/2}$ – 100 сағаттан асады (жасушаішілік қордан босап шығуы).
- Бүйрек функциясының жеткіліксіздігі бар науқастарда $T_{1/2}$, жеткіліксіздік дәрежесіне байланысты, 100 сағатқа дейін ауытқып отырады, муковисцидозы бар науқастарда – 1-2 сағат, күйікке шалдыққан және гипертермиясы бар науқастарда, клиренсінің жоғарылауы салдарынан, орташа көрсеткіштермен салыстырғанда қысқалау болуы мүмкін. Бүйректер арқылы шумақтық сүзілу жолымен (95%) өзгермеген күйінде шығарылады.

- **Фармакодинамикасы**

- Стрептомицин – аминогликозидтер тобына жататын, әсер ету ауқымы кең антибиотик. Сәулелі саңырауқұлақтардың **Streptomyces globisporus** немесе басқа да **Streptomyces spp.** түрлерінің тіршілігі барысында түзіледі.
- Төмен концентрацияларда бактериостатикалық әсер береді: микроб жасушасының ішіне еніп, рибосоманың 30S суббірлігінде спецификалық ақуыз-рецепторлармен байланысып, бұған түрткі болатын «рибосомның матрицалық РНҚ-30S суббірлігі» кешенінің түзілуін бұзады, нәтижесінде микроб жасушаларының өсуі мен дамуының тоқтауына әкеледі. Жоғарырақ концентрацияларда стрептомицин бактерицидтік әсер береді (цитоплазмалық жарғақшаларды зақымдап, микроб жасушаларын істен шығарады).

• Қолданылуы

- - орнығуы алуан түрлі туберкулезде, соның ішінде туберкулезді менингитте (біріктірілген ем құрамында)
- - венерологиялық гранулемада
- - туляремияда, бруцеллезде, обада
- - бактериялық эндокардитте (тек бензилпенициллинмен немесе ванкомицинмен біріктіріп)
- - жедел бактериялық ішек жұқпаларында
- - несеп шығару жолдарының жұқпаларында (қоздырғыштардың сезімталдығын анықтағаннан кейін)

Қолдану тәсілі және дозалары

- **Бұлшықет ішіне.**
- Құтының ішіндегіні инъекцияға арналған стерильді суда немесе 0.9% натрий хлориді ерітіндісінде немесе 0.25-0.5% прокаин (Новокаин) ерітіндісінде 1 г стрептомицинге шаққанда 4 мл еріткіш есебінен ерітеді. Ерітіндіні тура енгізер алдында дайындайды.
- **Ересектерге:** бұлшықет ішіне енгізгенде бір реттік доза – 0.5-1 г, тәуліктік – 1-2 г. Стрептомициннің ең жоғары тәуліктік дозасы ересектер үшін – 2 г. Жағымдылығы нашар болғанда, дене салмағы 50 кг-ден төмен науқастарға, сондай-ақ 60 жастан асқан адамдарға тәуліктік дозасы – 750 мг.
- **Балаларға:** 3 айлыққа дейін – дене салмағының әр кг шаққанда тәулігіне 10 мг доза есебінен, 3 айлықтан 6 айлыққа дейін – тәулігіне 15 мг/кг, 6 айлықтан 2 жасқа дейін – тәулігіне 20 мг/кг, 13 жасқа дейінгі балалар мен жасөспірімдер үшін – тәулігіне 15-20 мг/кг, бірақ 13 жасқа дейінгі балалар үшін тәулігіне 500 мг-ден аспайды және тәулігіне 1 г – жасөспірімдер үшін.

- Әртүрлі жастағы балаларға стрептомициннің ең жоғары дозалары:
- 2-4 жас – бір реттік – 150 мг, тәул – 300 мг;
- 5-6 жас – бір реттік - 175 мг, тәул - 350 мг;
- 7-9 жас – бір реттік - 200 мг, тәул- 400 мг;
- 9-14 жас – бір реттік - 250 мг, тәул - 500 мг;
- 14 жастан асқан – бір реттік 500 мг, тәул – 1 г.

- **Энтерококктік этиологияда** – 6 апта бойы стрептомицин бензилпенициллинмен біріктіріліп енгізіледі: алғашқы 2 аптада – тәулігіне 2 рет 1 г-ден; кейінгі төрт апта бойы – тәулігіне 2 рет 500 мг-ден
- **Туляремия** – 5-7-ші күнге дейін фебрильді температура жоқ болғанда 7-14 күн бойы тәулігіне 2 рет 0.5-1 г-ден.
- **Оба, бруцеллез** – кемінде 7-10 күн тәулігіне 2 рет 1 г .
- **Венералық гранулемада**, жедел бактериялық ішек жұқпаларында және несеп шығару жолдарының жұқпаларында – тәуліктік дозаны 2-4 енгізуге бөледі, курс ұзықтығы – кемінде 10 күн (14 күннен аспауы тиіс).
- **Бүйрек функциясының жеткіліксіздігінде** стрептомициннің тәуліктік дозасын азайтқан жөн. Креатинин клиренсі минутына 50-ден 60 мл-ге дейін болғанда доза тәулігіне 500 мг-ден аспауы тиіс; креатинин клиренсі минутына 40-тан 50 мл-ге дейін болғанда – тәулігіне 400 мг-ден аспайды.

Жағымсыз әсерлері

- Жиі
- - бас ауыру, ұйқышылдық, әлсіздік, шеткергі неврит, бет жүйкесінің невриті (бет аймағында немесе ауыз қуысында күйдіру сезімі, ұю, шаншу), көру жүйкесінің невриті
- - вестибулярлы және лабиринтті бұзылулар (қимыл үйлесімінің бұзылуы, бас айналу, жүректің айнуы, құсу, тұрақсыздық)
- - жүректің айнуы, құсу, диарея, бауыр функциясының бұзылуы ("бауырлық" трансаминаза белсенділігінің жоғарылауы, гипербилирубинемия)

Сирек:

- - миорелаксанттармен бір мезгілде енгізген кезде бұлшықеттердің құрысып жиырылуы, полинейропатия, парестезиялар, жүйке-бұлшықет блокадасы (тыныстың тарылуы, түнгі апноэ, тыныстың тоқтап қалуы), Естудің жоғалуы, құлақтың шыңылдауы, шуылдауы, немесе құлақтың «бітелу» сезімі, естудің қайтымсыз кереңдікке дейін төмендеуі)
- Нефроуыттылық (несеп шығару жиілігінің елеусіз артуы немесе азаюы, олигурия, полиурия, альбуминурия, гематурия, шөлдеу, анорексия, жүректің айнуы, құсу)
- Гиперемия және енгізген жерде ауыру
- Аллергиялық реакциялар: сирек – қышыну, тері гиперемиясы, бөртпе, өте сирек – ангионевротикалық ісіну, қызба, эозинофилия, бронхтың түйілуі, анафилактикалық шок
- Артериялық қысымның төмендеуі, жүрек тұсының қысылып ауыруы, тахикардия, гипотензия

Қолдануға болмайтын жағдайлар

- - стрептомицинге (соның ішінде сыртартқысында басқа аминогликозидтерге) жоғары сезімталдық
- - жүрек-қантамыр функциясы жеіткіліксіздігінің ауыр түрлері
- - азотемиямен және уремиямен бүйрек функциясының созылмалы жеткіліксіздігі
- - ми қан айналымының бұзылуы
- - облитерациялық эндартериит
- - миастения
- - паркинсонизм
- - ботулизм
- - қан кетулерге бейімділік
- - эпилепсия
- - жүктілік және лактация кезеңі