

## ЛЕКЦИЯ

### АНТИБИОТИКИ - I

*(пенициллины, цефалоспорины, карбапенемы, монобактамы, макролиды).*



# Ермольева З.В.



# $\beta$ -лактамыные АБ

1. **Пенициллины**
2. **Цефалоспорины**
3. **Карбапенемы** (*имипенем, меропенем*)
4. **Монобактамы** (*азтреонам*)

# Классификация

1 генерация:

**Природные пенициллины** (на Gr "+" флору)

- **короткого действия:**

**1. Бензилпенициллин**

**2. Феноксиметилпенициллин** (*оспен, фау-  
пенициллин*)

- **длительного действия:**

**1. Бензатин-бензилпенициллин** (*бициллины 1,5;  
ретарпен*)

## 2. Полусинтетические пенициллины

### 2 генерация:

*Пенициллины, резистентные к пеницилиназе (на Гр<sup>++</sup> флору) – антистафилококковые*

**1. Оксациллин**

**2. Клоксациллин**

**3. Диклоксациллин**

### 3 генерация

*Аминопенициллины: кислотоустойчивые (на Гр<sup>++</sup> и Гр<sup>-</sup> флору)*

**1. Ампициллин**

**2. Амоксициллин**  
*(флемоксин солютаб)*

**3. Пивампициллин**

# Полусинтетические пенициллины с антипсевдомонадной активностью (антисинегнойные)

## 4 генерация:

### • Карбоксипенициллины

1. Карбенициллин

2. Тикарциллин

### • Уреидопенициллины

1. Азлоциллин

2. Пиперациллин

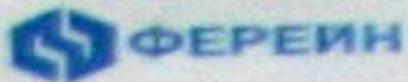
# Комбинированные пенициллины

## 1. Широкого спектра: **Ампиокс** (ампициллин + оксациллин)

- *в настоящее время теряет клиническое значение*

## 2. С ингибиторами $\beta$ -лактамаз:

- **Уназин:** ампициллин + *сульбактам*
- **Амоксиклав:** амоксициллин + *клавулановая кислота*



ФЕРЕИН

**АМПИОКС® 0,25 г**  
**В КАПСУЛАХ**  
**20 КАПСУЛ**

1 КАПСУЛА СОДЕРЖИТ:

АМПИЦИЛЛИНА  
(В ФОРМЕ ТРИГИДРАТА) 0,125 Г  
ОКСАЦИЛЛИНА  
(В ФОРМЕ НАТРИЕВОЙ СОЛИ) 0,125 Г

Р. 77/770/3



# Ингибиторы бета-лактамаз

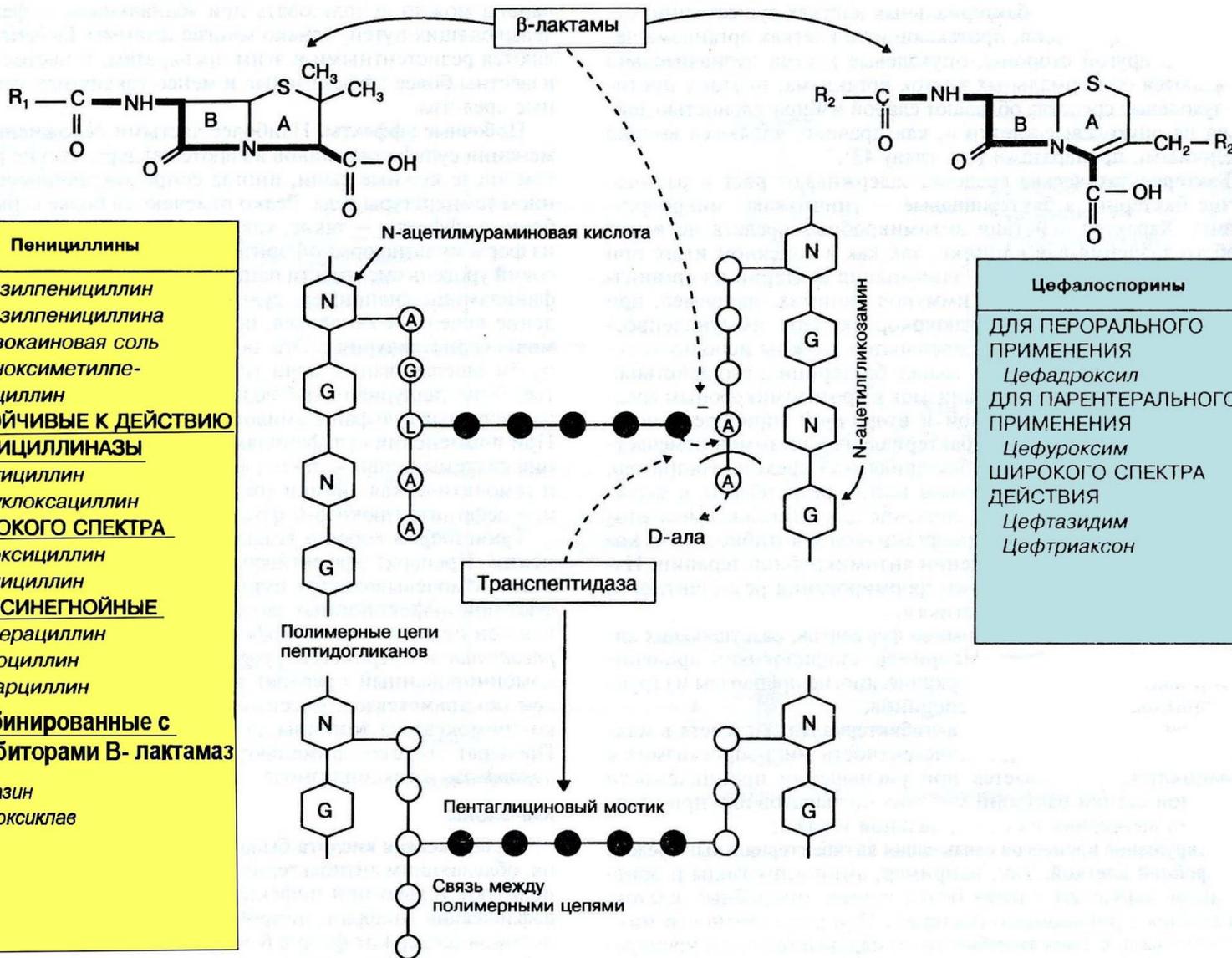
- Клавулановая кислота
- Сульбактам
- Тазобактам

Препараты, содержащие пенициллины и ингибиторы бета-лактамаз (**защищенные пенициллины**)

**Уназин** (Ампициллин + **сульбактам**)

**Амоксиклав** (Амоксициллин + **клавулановая кислота**)

# Противомикробные средства, угнетающие синтез белков клеточной стенки бактерий: пенициллины, цефалоспорины и ванкомицин



**1 поколение**

Оральные:  
Цефалексин  
Цефадроксил

Парентеральные:  
Цефазолин  
Цефалотин  
Цефалоридин

**2 поколение**

Оральные:  
Цефуроксил-аксутил  
Цефаклор

Парентеральные:  
Цефуросим  
Цефотаксин  
Цефтриаксон

**3 поколение**

Парентеральные:  
Цефтриаксон

С антисинегнойной активностью:  
Цефтазидим  
Цефоперазон  
Цефодизим

**4 поколение**

Цефпиром  
Цефепим

- Пенициллины**
- Бензилпенициллин
  - Бензилпенициллина новокаиновая соль
  - Феноксиметилпенициллин
- УСТОЙЧИВЫЕ К ДЕЙСТВИЮ ПЕНИЦИЛЛИНАЗЫ**
- Метициллин
  - Флуоксациллин
- ШИРОКОГО СПЕКТРА**
- Амоксициллин
  - Ампициллин
- АНТИСИНЕГНОЙНЫЕ**
- Пиперациллин
  - Азлоциллин
  - Тикарциллин
- Комбинированные с ингибиторами В- лактамаз**
- Уназин
  - Амоксиклав

- Цефалоспорины**
- для ПЕРОРАЛЬНОГО ПРИМЕНЕНИЯ
- Цефадроксил
- для ПАРЕНТЕРАЛЬНОГО ПРИМЕНЕНИЯ
- Цефуросим
- ШИРОКОГО СПЕКТРА ДЕЙСТВИЯ
- Цефтазидим
  - Цефтриаксон

## Спектр активности природных пенициллинов

### Высокочувствительные:

- **Гр «+» кокки** (*стрептококки*, *пневмококки*)
- **Гр «-» кокки** (*гонококк*, *менингококк*)
- **Спирохеты** (*Treponema*, *Borrelia*, *Leptospira*)
- **Анаэробные бактерии** (*актиномицеты*, *Peptostreptococcus spp.*, *Clostridium spp.*).

### Чувствительные:

- **Гр «-» бактерии** (*Neisseria spp.* и др.)

# Показания к применению природных пенициллинов

## 1. Инфекции, вызванные *Str. ruogenes*, и их последствия:

- тонзиллофарингит
- скарлатина
- рожа
- круглогодичная профилактика ревматизма

## 2. Инфекции, вызванные *Str.pneumoniae*:

- внебольничная («домашняя») пневмония
- менингит
- сепсис



### **3. Инфекции, вызванные другими стрептококками:**

- инфекционный эндокардит (*в комбинации с гентамицином или стрептомицином*);

**4. Сифилис**

**5. Газовая гангрена**

**6. Актиномикоз**





Ретарпен®  
2400000 ME

Хранить в холодильнике  
температура ниже 25°C в защищенном месте







Амоксилав<sup>®</sup>

500 мг + 125 мг  
таблетки покрытые  
пленочной оболочкой

AMOXICILLIN +  
CLAVULANIC ACID

 lek

15 таблеток покрытых  
пленочной оболочкой



# Взаимодействия пенициллинов

<i>Взаимодействующее лек. средство</i>	<i>Результат (эффект) взаимодействия</i>
<b>Аминогликозиды</b>	<i>Выраженный синергизм, но их нельзя смешивать в одном шприце (инактивация АГ)</i>
<b>Тетрациклины</b>	<i>Нежелательная комбинация</i>
<b>Сульфален</b>	<i>Повышается степень связывания сульфалена с белками плазмы</i>
<b>Преднизолон</b>	<i>Снижается концентрация пенициллина в тканях</i>
<b>Инсулин</b>	<i>Снижается концентрация пенициллина в тканях</i>
<b>Бутадион</b>	<i>Уменьшает почечный клиренс (выведение) пенициллина</i>
<b>К-ты, щелочи, Спирты, КМnO<sub>4</sub>, Перекись водорода, соли тяжелых металлов</b>	<i>Химический антагонизм (инактивация и разрушение)</i>

# КЛАССИФИКАЦИЯ ЦЕФАЛОСПОРИНОВ

(зарегистрированные в России цефалоспорины)

**1 поколение** – преимущественная  
активность против Гр + кокков

- **оральные:**

1. **Цефалексин** (*Орацеф, Споридекс*)

2. **Цефадроксил**

- **парентеральные:**

1. **Цефазолин** (*Кефзол*)

2. **Цефалотин** (*Кефлин*)

3. **Цефалоридин**





## 2 поколение

преимущественная активность против Гр «-» кокков,  
Гр «-» бактерий (*E. coli*, *Proteus vulgaris*, *Enterobacter*)

- оральные:

1. **Цефуроксим-аксетил** (для приема внутрь  
– *Кетоцеф*)

2. **Цефаклор** (*Альфацет, Цеклор*)

- парентеральные:

1. **Цефотаксим** (*Клафоран*)

2. **Цефуроксим** (*Зиннат*)

CEFOTAXIME-ASTRAPHARM



**ЦЕФОТАКСИМ-АСТРАФАРМ**

5 флаконів



**Клафоран®**

Цефотаксима  
натриєвая соль

**1г**

Для внутримышечного  
и внутривенного  
введения

1 флакон



Hoechst Marion Roussel

9579

**Клафоран®**

цефотаксима натриєвая соль

Для внутримышечного  
и внутривенного введения

Hoechst Marion Roussel



# 3 поколение

*спектр 2-й группы + выраженная антисинегнойная активность*

- **парентеральные:**

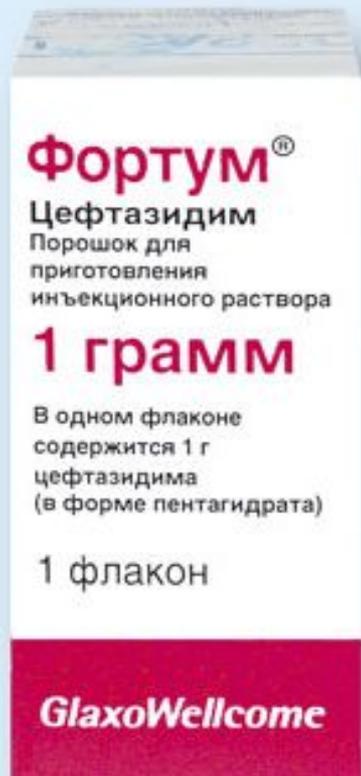
1. **Цефтриаксон** (*Лонгацеф, Роцефин*)

- **с антипсевдомонадной активностью:**

1. **Цефтазидим** (*Фортум*)

2. **Цефоперазон**  
(*Цефобид*)





# 4 поколение высокая активность против Гр «+» и Гр «-» анаэробов, спектр 2 и 3 групп

## 1. Цефпиром (Кейтен)



## 2. Цефепим (Максипим)



# Карбапенемы



Природные макролиды: (1 поколение)

1. **Эритромицин** (Эрацин, Эритран)

2. **Олеандомицин** (применяется редко или в виде **Олететрина**)



3. **Джосамицин** (вильпрафен)

**Полусинтетические: (2 поколение)**

- 1. Азитромицин (Сумамед)**
- 2. Кларитромицин (Клацид)**
- 3. Мидекамицина ацетат  
(Макропен)**
- 4. Ровамицин (Спирамицин)**
- 5. Рокситромицин (Рулид)**

**Ровамицин® 3 млн МЕ**  
(спирамицин)

10 таблеток

 **SPECIA  
RHONE-POULENC RORER**  
16 RUE CLISSON 75013 PARIS FRANCE



Аптека На Дом

14 таблеток

№ M299

**КЛАЦИД® СР** 500 мг

Таблетки пролонгированного действия покрытые оболочкой

Кларитромицин 500 мг

 **ABBOTT**



**400  
МГ**

**Макропен®**  
таблетки, покрытые оболочкой

Мидекамицин

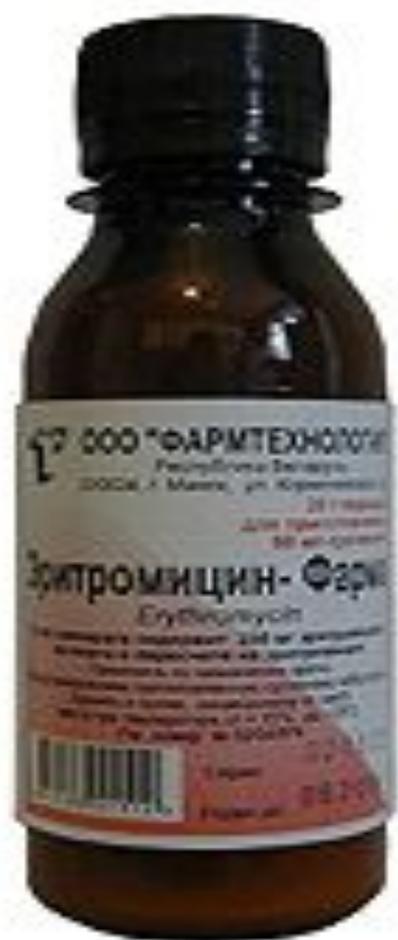
**16 таблеток**

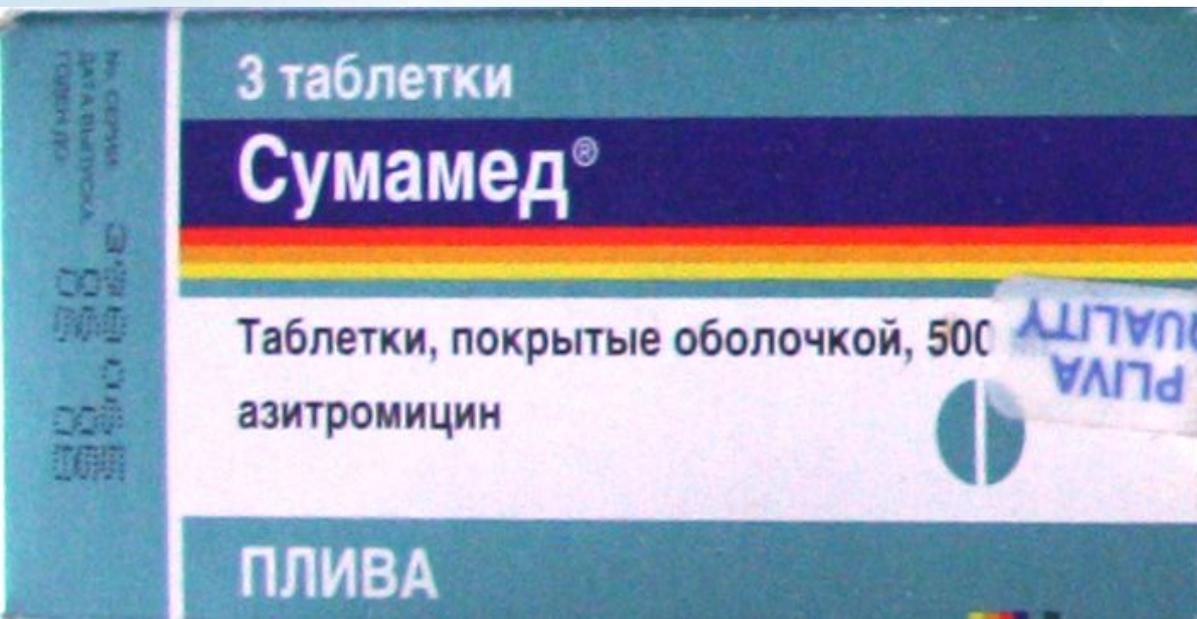
 **KRKA**





**комплексный препарат для системного применения в лечении язвенной болезни желудка**  
**кларитромицин + омепразол + тинидазол**





**РУЛИД®**

**150 мг**

Рокситромицин

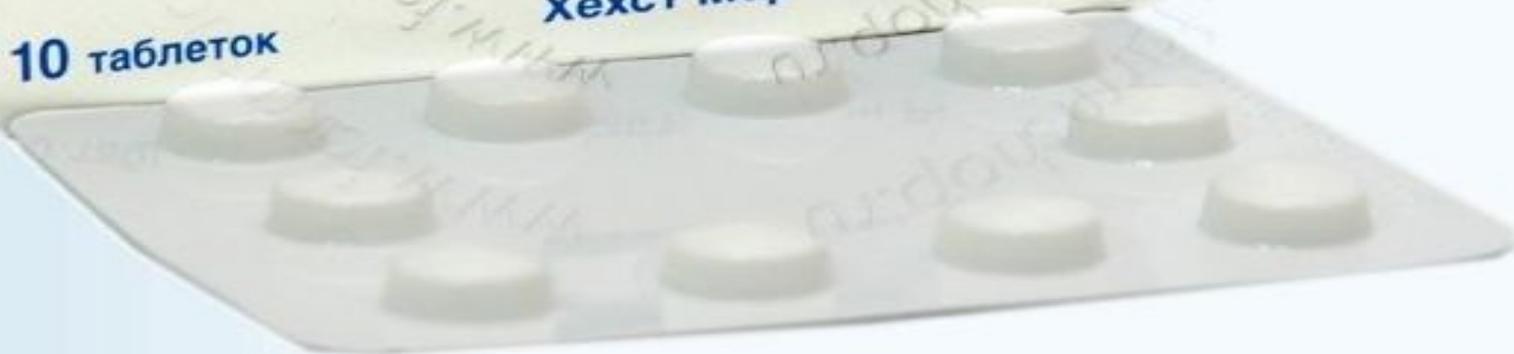
Противомикробное средство  
из группы макролидов

для взрослых

10 таблеток

Хёхст Мэрион Руссель

РЖ 040023



# РоксиГЕКСАЛ® 50 мг

Рокситромицин

Антибиотик макролид



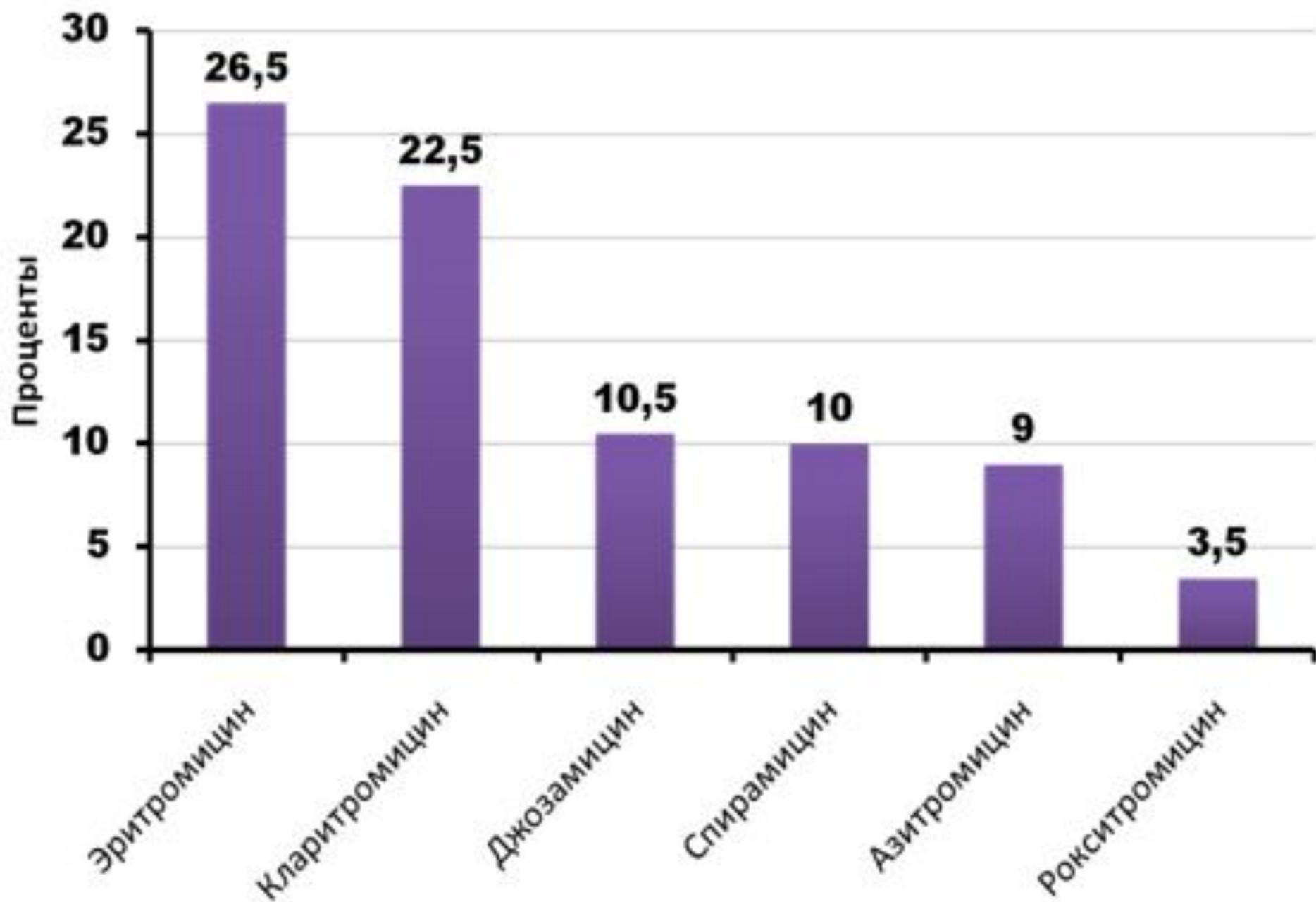
Таблетки, покрытые оболочкой **N 10**



Рис. 3. Клиническая эффективность и переносимость различных макролидов при обострении хронического тонзиллита у детей



Частота нежелательных реакций при назначении макролидов



## Лекарственное взаимодействие макролидов (Страчунский Д.С. 1996)

Макролиды	Препараты	Результат взаимодействия
Эритромицин, Кларитромицин, Мидекамицин	Непрямые антикоагулянты	<i>Усиление гипопротромбинемии</i>
	Карбамазепин (финлепсин)	<i>Повышение токсичности карбамазепина из-за увеличения его сывороточной концентрации</i>
Эритромицин, Кларитромицин	Сердечные гликозиды (дигоксин)	<i>Повышение токсичности дигоксина из-за увеличения его сывороточной концентрации</i>
Эритромицин, Кларитромицин, Джосамицин	Антигистаминные (терфенадин, астемизол)	<i>Высокий риск развития желудочковых аритмий</i>
Эритромицин Кларитромицин, Рокситромицин, Джосамицин	Теофиллин	<i>Повышение токсичности теофиллина из-за увеличения его сывороточной концентрации</i>
Эритромицин	Бензодиазепины (триазолам, мидозолам)	<i>Усиление седативного эффекта бензодиазепинов</i>
	Вальпроевая кислота (депакин, конвулекс)	<i>Усиление седативного эффекта вальпроатов</i>
	Метилпреднизолон	<i>Пролонгирование эффекта метилпреднизолона</i>
Эритромицин, Кларитромицин	Дизопирамид (ритмилен, ритмодан)	<i>Повышение риска развития токсичности дизопирамида</i>