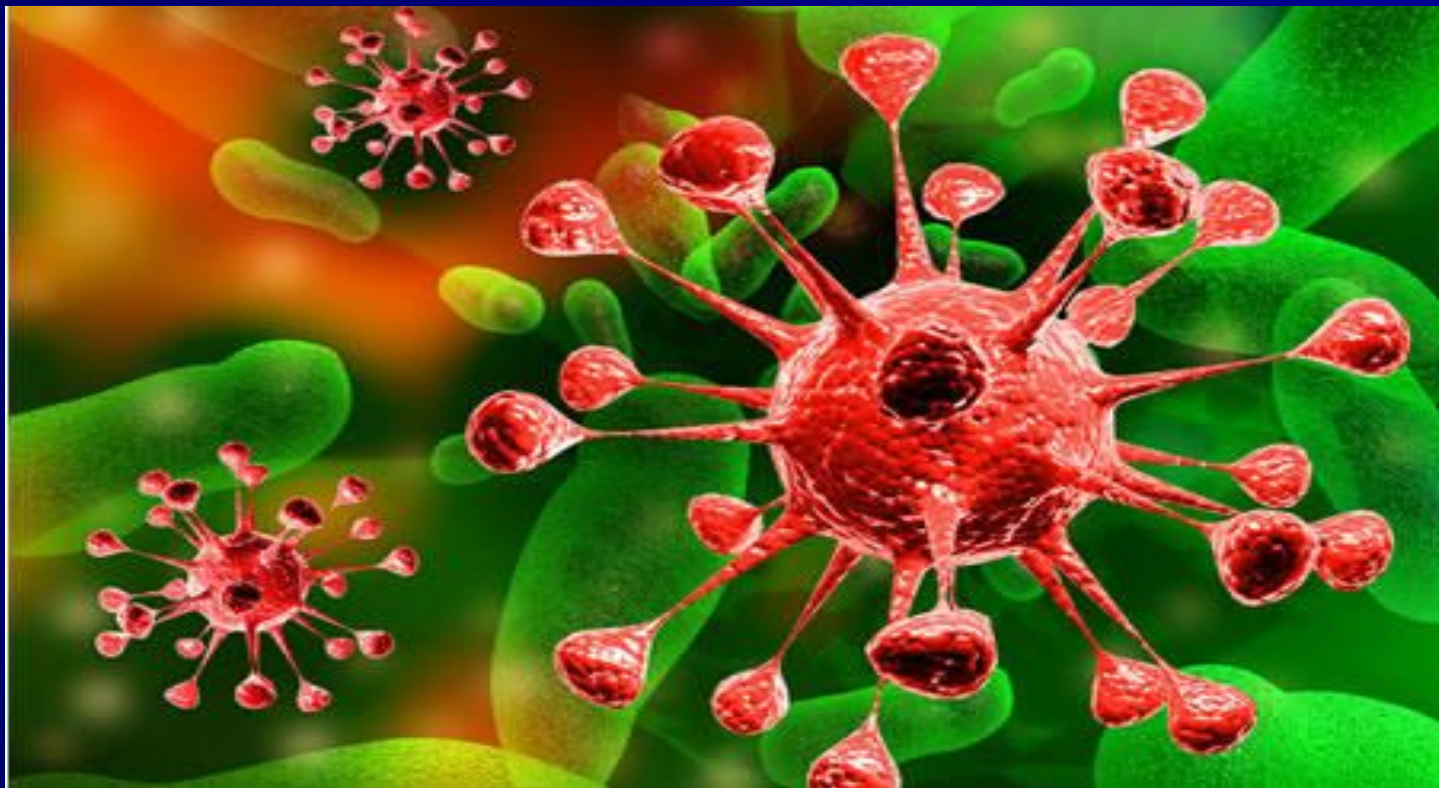


АНТИБИОТИКИ



- **Антибиотики** – вещества природного происхождения, оказывающие повреждающее или губительное действие на микроорганизмы, в основе действия которых лежит принцип специфического антагонизма – антибиоза, при котором одни виды живых существ выделяют в окружающую среду специфические вещества, угнетающие жизнедеятельность других видов.

Классификация антибиотиков по химическому строению

I. Препараты, имеющие в структуре бета-лактамно́е кольцо.

A. Пенициллины:

B. Цефалоспорины:

Г. Других классов:

_____ а) тиеномицины - тиенам;

_____ б) монобактамы - азактам.

II. Тетрациклины.

III. Аминогликозиды.

IV. Макролиды.

V. Левомецетины - левомицетин (хлорамфенинол);

VI. Рифампицины - рифампицин, рифамицин.

VII. Линкомицины - линкомицин (линкоцин), клиндамицин

VIII. Полипептидной природы:

а) полимиксины - полимиксин В сульфат (аэроспирин);

б) гликопептиды - ванкомицин (ванкоцин), ристомицина сульфат.

IX. Другие: фузидин натрий, фосфомицин (фосфоцин), новомицин (альбомицин, атомицин).

Классификация антибиотиков по механизму действия

- 1. Препараты, ингибирующие синтез клеточной стенки, - пенициллины, цефалоспорины, ванкомицин, фосфомицин, ристомицин.
- 2. Нарушающие функцию клеточной мембраны - полимиксины, полианы
- 3. Препараты, угнетающие синтез белка и нарушающие функцию рибосом - аминогликозиды, левомицетин, макролиды, фузидин, тетрациклины.
- 4. Ингибирующие синтез РНК на уровне РНК-полимеразы - рифампицины, линкомицины, рифамицины, линкоцины.
- 5. Препараты, ингибирующие синтез РНК на уровне ДНК-матрицы - актиномицины.
- 6. Препараты, тормозящие синтез ДНК на уровне ДНК-матрицы - стрептомицин, брунеомицин, блеомицин, гентамицин, антрациклины.

Классификация антибиотиков по характеру антимикробного действия

- 1. Бактерицидный тип - биосинтетические и полусинтетические пенициллины, аминогликозиды, полимиксины, ванкомицин, ристомицин, цефалоспорины, фосфомицин, рифамицины.
- 2. Бактериостатического типа действия - макролиды, тетрациклины, левомицетин, линкомицин, фузидин.

Классификация антибиотиков по спектру антибактериального действия

- 1. Препараты активные в отношении Гр + микроорганизмов и Гр - КОККОВ:
 - а) с выраженным бактерицидным действием - пенициллин, ванкомицин, цефалоспорины, фосфацидин, ристомицин, ципротан, аминогликозиды;
 - б) бактерицидное действие, которое проявляется только в высоких концентрациях - макролиды, линкомицин;
 - в) действующие только бактериостатически - фузидин.
- 2. Препараты широкого типа действия с бактериостатическим типом - тетрациклины, левомицетин.
- 3. Препараты широкого спектра, высокоселективные в отношении Гр - возбудителей с бактерицидным действием - аминогликозиды, хинолоны (ципробай, таривид), полимиксины.

Пенициллины:

- А. 1-го поколения (природные пенициллины) - бензилпенициллина натриевая соль, бензилпенициллина калиевая соль;
- феноксиметилпенициллин,
- бензилпенициллина новокаиновая соль, бициллин-1, бициллин-5.

Спектр противомикробного действия природные пенициллины:

грамположительные и грамотрицательные кокки (за исключением пеницилиназообразующих штаммов эпидермального и золотистого стафилококков, энтерококков), палочки (листерии, дифтерийная, сибиреязвенная палочки), спирохеты (бледная спирохета, лептоспиры, боррелии), спорообразующие анаэробы (клостридии), споронеобразующие анаэробы (пептострептококки, фузобактерии), актиномицеты.

Пенициллины:

Б. Полусинтетические пенициллины:

- а) 2-го поколения
(пенициллиназоустойчивые с
преимущественной активностью в
отношении Гр + микроорганизмов)
 - оксациллин,
флуксациллин,
нафициллин;

Спектр противомикробного действия:

- Полусинтетические пенициллины:
Пеницилиназоустойчивые пенициллины имеют спектр противомикробного действия, аналогичный таковому природных пенициллинов, а также воздействуют на пеницилиназообразующие стафилококки.

Пенициллины:

Б. Полусинтетические пенициллины:

- б) 3-го поколения -
аминопенициллины (широкого
спектра действия) -
ампициллин,
амоксициллин;

Спектр противомикробного действия:

- Ампициллин и амоксициллин имеют аналогичный природным пенициллинам спектр действия, а также дополнительно влияют на энтерококки, сальмонеллы, шигеллы, протей, кишечную палочку, гемофильную палочку, активные в отношении большинства Гр - /кроме синегнойной палочки, Гр +, пенициллиназообразующих стафилококков/, микроорганизмов)

Пенициллины:

Б. Полусинтетические пенициллины:

- в) Активные в отношении синегнойной палочки
 - Кабоксипенициллины –
карбеницилин, карфециллин,
тикарциллин;
 - Уреидопенициллины –
пиперациллин, азлоциллин.

Спектр противомикробного действия:

- Карбенициллин, тикарциллин (карбоксипенициллины), азлоциллин, пиперациллин (уреидопенициллины) дополнительно действуют на бактероиды (в высокой концентрации) и некоторые штаммы синегнойной палочки.

Пенициллины:

В. Комбинированные:

- Ампиокс (ампициллин+оксицилин);
- уназин (ампициллин+сулбактам),
- амоксиклав
(амоксициллин+клавулановая к-та).

цефалоспорины:

а) 1-го поколения (широкого спектра действия, с преимущественным влиянием на Гр - флору, устойчивые к стафилококковой бета-лактамазе):

- цефалотин,
- цефалоридин,
- цефазолин,
- цефалексин,
- цефрадин,
- цефацетрил,
- цефамицин;

Спектр противомикробного действия цефалоспоринов.

- Цефалоспорины первого поколения имеют спектр действия, сочетающий активность ампициллина и пенициллиназоустойчивых пенициллинов. В отличие от ампициллина, они не действуют на энтерококки и гемофильную палочку, подобно ампициллину не влияют на синегнойную палочку и *Bacteroides fragilis* и разрушаются β -лактамазами грамотрицательных бактерий.

цефалоспорины:

б) 2-го поколения (широкого спектра действия, устойчивые к бета-лактамазе Гр - микроорганизмов /эктеробактерии, серрании/, бактероиды) –

- цефаклор,
- цефуроксим,
- цефамандол,
- цефокситин;

Спектр противомикробного действия цефалоспоринов.

- Цефалоспорины второго поколения устойчивы к β -лактамазам (особенно цефуроксим), в связи с чем более эффективны в отношении стафилококков, кишечной и гемофильной палочек, сальмонелл, шигелл, клебсиелл, *Branhamella catarrhalis*, индолотрицательных штаммов протей, некоторых штаммов энтеробактерий и *Serratia marcescens*. Они неэффективны при инфекциях, вызванных синегнойной палочкой, кампилобактерами, индолположительными штаммами протей, многими штаммами *Serratia*, акинетобактеров. По действию на грамположительную микрофлору препараты этой группы не отличаются от цефалоспоринов первого поколения.

цефалоспорины:

В) 3-го поколения (широкого спектра, преимущественно влияют на Гр - микрофлору) –

- цефотаксим,
- цефтазидим,
- цефтриаксон,
- цефсулодин,
- цефменоксим,
- цефиксим,
- цефтизоксим,
- цефаперазон;

Спектр противомикробного действия цефалоспоринов.

- Цефалоспорины третьего поколения обладают высокой устойчивостью к β -лактамазам. Цефотаксим и другие препараты этой группы высокоактивны в отношении *Haemophilus influenzae*, *Enterobacter* (включая больничные полирезистентные штаммы), *Klebsiella pneumoniae*, *Branhamella catarrhalis*, *Proteus vulgaris*, кишечной палочки, акинетобактеров, цитробактеров, серраций, провиденций (в том числе устойчивых к аминогликозидам); умеренно подавляют синегнойную палочку и *Bacteroides fragilis*, уступают цефалоспорином первого и второго поколений по воздействию на кокковую микрофлору (однако сохранена высокая эффективность в отношении стрептококков, гонококков и менингококков). Активность в отношении анаэробной микрофлоры аналогична таковой у цефалоспоринов первого поколения.

цефалоспорины:

г) 4-го поколения

(производные цефамицинов):

- монсолактам,
- цефепим,
- цефпиром.

Спектр противомикробного действия цефалоспоринов.

- Цефалоспорины четвёртого поколения имеют большую по сравнению с другими цефалоспоринами активность в отношении синегнойной палочки.

КАРБАПИНЕМЫ

- ▣ ИМИПИНЕМ (+ЦЕЛАСТАТИН = ТИЕНАМ);
- ▣ МЕРОПИНЕМ (МЕРОНЕМ).

Тетрациклины.

1. Естественные тетрациклины - тетрациклин, окситетраксина дигидрат.
2. Полусинтетические тетрациклины - доксациклина гидрохлорид (вибрамицин), метациклина гидрохлорид (рондомицин), миноциклин (клиномицин).
3. Комплексные препараты - эрициклин, олететрин (тетраолеан, сигмамицин).

Спектр противомикробного действия тетрациклинов.

- группа бактериостатических антибиотиков широкого спектра действия. Они активны в отношении грамположительных и грамотрицательных кокков, особенно гонококков, пневмококков и *Branhamella catarrhalis* (50% штаммов гемолитического стрептококка и 70% штаммов энтерококков устойчивы), листерий, возбудителя сибирской язвы, иерсиний, хламидий, микоплазм, кампилобактерий, бруцелл, Haemophilus influenzae, Haemophilus ducreyi, холерного вибриона, риккетсий, бледных спирохет, клостридий (кроме *Clostridium difficile*), фузобактерий, Propionibacterium acnes.

АМИНОГЛИКОЗИДЫ

- а) 1-го поколения - стрептомицина сульфат, неомицина сульфат, мономицин (паромомицин), канамицин;
- б) 2-го поколения - гентамицин, гарамицин;
- в) 3-го поколения - сизомицин (экстрамицин), тобрамицин (бруломицин, небцин), амикацин (амикин), нетилмицин (нетромицин).

Спектр противомикробного действия аминогликозидов.

- Аминогликозиды первого поколения. Широко применяют только канамицин. Стрептомицин в основном используют как противотуберкулёзный препарат. Канамицин, активен по отношению к пневмококкам, энтерококкам и многим внутрибольничным грамотрицательным штаммам бактерий, не действует на синегнойную палочку.
- Аминогликозиды второго поколения активны в отношении синегнойной палочки, действует на штаммы микроорганизмов, выработавших устойчивость к аминогликозидам первого поколения.
- Аминогликозиды третьего поколения более активны в отношении синегнойной палочки.

Макролиды:

- • природные — джозамицин, мидекамицин, олеандомицин, эритромицин;
- • полусинтетические — азитромицин, диритромицин, кларитромицин, рокситромицин, спирамицин.

Спектр противомикробного действия макролидов.

- Макролиды **активны** в отношении стрептококков, стафилококков (в том числе пенициллиназопродуцирующих), гонококков, *Branhamella catarrhalis*, клостридий, палочек сибирской язвы, листерий, коринебактерий дифтерии, легионелл, *Bordetella pertussis*, кампилобактеров, умеренно активны в отношении гемофильной палочки. К макролидам **очень чувствительны** микоплазмы, хламидии и спирохеты, **нечувствительно** большинство грамотрицательных бактерий и энтерококки.

Линкомицины - линкомицин (линкоцин), клиндамицин

- Спектр противомикробного действия

Препараты **активны** в отношении большинства **грамположительных кокков** (исключая энтерококки и метициллинрезистентные стафилококки), **некоторых грамотрицательных палочек** (*Bacillus anthracis*), **микоплазм, гемофильной палочки, бактериоидов, спорообразующих анаэробов.** Линкозамиды уступают эритромицину в активности **в отношении спорообразующих анаэробов, нейссерий, коринебактерий.** Линкозамиды рассматривают как **препараты резерва при стрептококковых и стафилококковых инфекциях, а также при заболеваниях, вызванных спорообразующими анаэробами.**

Антибиотики полипептидной природы:

а) полимиксины - полимиксин В
сульфат (аэроспирин);

б) гликопептиды - ванкомицин
(ванкоцин), ристомицина сульфат
(ристоцин спонтин).

Спектр противомикробного действия

- Полимиксины - препараты резерва для лечения инфекций, вызванных синегнойной палочкой, например сепсиса, менингитов (вводят интралюмбально), пневмоний, инфекций мочевых путей.
- Гликопептиды - бактерицидные антибиотики, относящийся к резервным. Наиболее чувствительны к ристомицину грамположительные кокки (включая энтерококки и метициллинрезистентные стафилококки, устойчивые к действию хлорамфеникола, тетрациклина и других антибиотиков). Лишь очень немногие штаммы устойчивы к ристомицину.