

СИНТЕТИЧЕСКИЕ ПРОТИВОМИКРОБНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА

ЛЕКЦИЯ 8



ПОНЯТИЕ О ВОЗБУДИТЕЛЯХ ИНФЕКЦИЙ

Инфекционное заболевание - это заболевание, вызываемое проникновением в организм человека болезнетворных микроорганизмов.

Причинным фактором инфекционных заболеваний является **возбудитель**.

Классификация возбудителей инфекций человека предполагает **6 основных групп** (в порядке усложнения их организации): **прионы, вирусы, бактерии, грибки, простейшие и гельминты**.

Они являются возбудителями, соответственно, *прионных, вирусных, бактериальных, грибковых (микозы), протозойных инфекций и гельминтозов*.



ХИМИОТЕРАПЕВТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА ДРУГИХ ГРУПП

- Сульфаниламидные препараты
- Производные нитрофурана
- Производные нитроимидазола
- Фторхинолоны
- Противотуберкулезные



СУЛЬФАНИЛАМИДЫ



- это препараты широкого спектра бактериостатического действия. В 1956 Герхард Домагк показал химиотерапевтические свойства первого из них — **пронтозила** — при стрептококковых инфекциях.

Сульфаниламидные препараты

- относятся к **группе синтетических антибактериальных средств**, являются производными амида сульфаниловой кислоты, **обладают широким спектром действия**



СУЛЬФАНИЛАМИДЫ

являются **конкурентными антагонистами**

(парааминобензойная кислота) ПАБК, **ПАБК** (витамин В10). В организме человека не вырабатывается, но синтезируется многими бактериями, грибами и растениями.

ПАБК участвует в образовании фолиевой кислоты (является её предшественником), участвует в синтезе пуринов и пиримидинов, из которых образуются азотистые основания, входящие в состав нуклеиновых кислот – РНК и ДНК.

Уступают по активности антибиотикам, но имеют **преимущества:**

1. Малая токсичность (можно применять в амбулаторной практике)
2. Нет противопоказаний в детском возрасте
3. Относительно низкие цены

Препараты обладают **бактериостатическим** противомикробным эффектом (в условиях иммунодефицита не активны), активны только против **делящихся штаммов**.

В настоящее время расширяется спектр микроорганизмов устойчивых к СА. Поэтому применять их стали реже.



МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ СА

1. Препараты **действуют только в высоких концентрациях** (концентрация препарата в месте действия должна превышать концентрацию ПАБК в десятки и сотни раз)
2. СА **малотоксичны для животных клеток** (в том числе для клеток человека) из-за того, что в животных клетках не синтезируется (не происходит синтез дигидрофолиевой кислоты - она захватывается готовой). Но в печени происходит гидрирование дигидрофолиевой кислоты под действием фолатредуктазы.
3. **Микроорганизмы становятся резистентным к действию СА**, если синтезируют ПАБК в больших количествах.

Сульфаниламиды неэффективны

- В средах, где много ПАБК (гной, раневое отделяемое)
- В присутствии антагонистов СА (новокаин, анестезин, метионин, пуриновых и пиримидиновых оснований, фолиевой кислоты)



- Побочные эффекты, на которые нужно обращать особое внимание
- Реакции гиперчувствительности
- Фотодерматоз
- Гематологические поражение печени
- Суперинфекция (грибковая)
- Синдром красной волчанки
- Тератогенность

- Другие побочные эффекты
- Поражение ЖКТ
- Поражение ЦНС
- Поражение почек – **кристаллурия**
- Антивитаминное действие – В1, В2, В6, РР
- Угнетение функции щитовидной железы

Меры профилактики кристаллурии: запивать **щелочной** минеральной водой или содовым раствором



КЛАССИФИКАЦИЯ СА

- Хорошо всасываются в ЖКТ и обладают резорбтивным действием

□ **Короткие** (8ч) – стрептоцид, норсульфазол, сульфадимезин

□ **Средние** (8-16ч) – сульфадиметоксин

□ **Длительные** (24-48ч) – сульфален

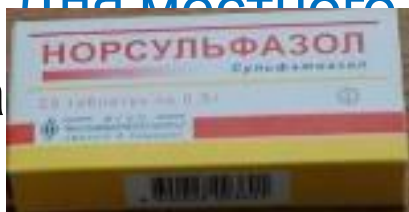
- Плохо всасывающиеся в ЖКТ – фталазол, сульгин

- Комбинированные

с триметропином – ко-тримоксазол (бактрим, бисептол)

- Для местного при

(а



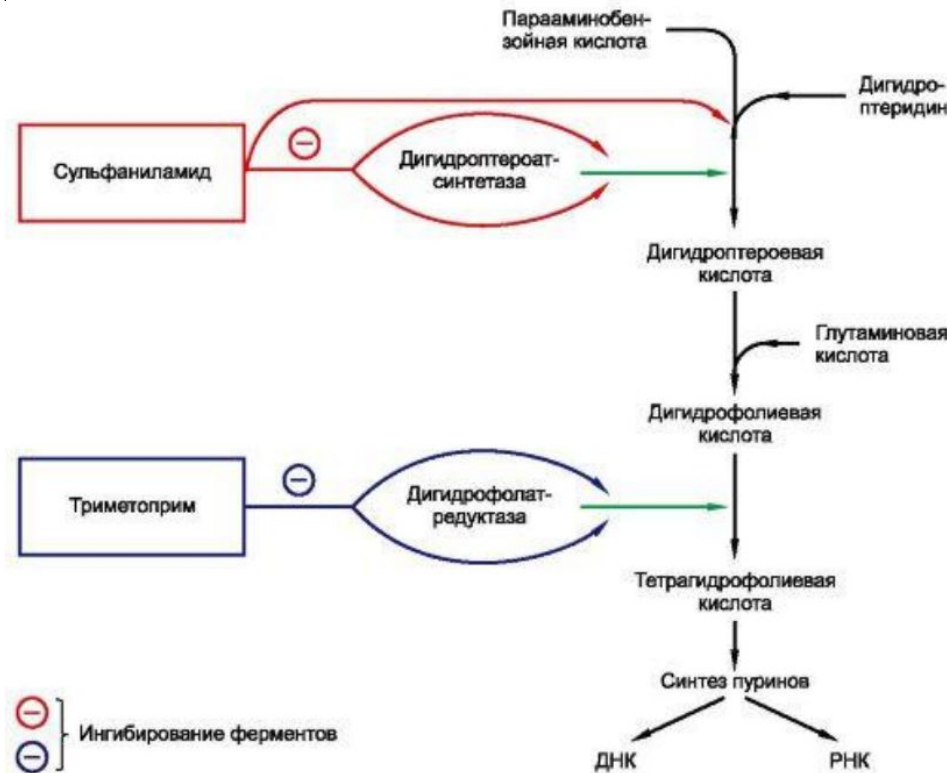
фа



СУЛЬФАНИЛАМИДНЫЕ ПРЕПАРАТЫ

Комбинированные препараты:

а) комбинация сульфаниламида с триметопримом: угнетение синтеза как фолиевой, так и фолиновой кислот, за счет чего действие становится бактерицидным:



НАЗНАЧЕНИЕ СА

- СА, хорошо всасывающиеся в ЖКТ:

для систематической лечения инфекций, вызванных чувствительными микроорганизмами: инфекции дыхательных путей и мочевыводящих путей

- СА, плохо всасывающиеся в ЖКТ и создающие высокую антибактериальную концентрацию в тонком и толстом

кишечнике, назначаются только внутрь. Применяют для лечения **острых энтеритов, бактериальной дизентерии, колитов и энтероколитов.** Обычно их назначают 4-6 раз в сутки в средних дозах 4-6 грамм в течение 5-7 дней.

- СА для местного применения: назначают при воспалительных **заболеваниях конъюнктивы глаза, блефаритах, гнойных язвах роговицы; весьма эффективен при трахоме.**

- Комбинированные препараты **оказываются эффективными в тех случаях, когда лечение только**



СХЕМА НАЗНАЧЕНИЯ СУЛЬФАНИЛАМИДОВ

В первый день лечения сульфаниламиды назначают в высоких ("ударных") дозах и затем переходят к лечению поддерживающими дозами. Величину доз и частоту приемов

сульфаниламидов устанавливают в зависимости от

Величины дозы и частоты приема

Сульфаниламидные препараты	Дозы и режим приемов		
	1-ый день приема		Последующие дни приема
	«ударная»	Последующие приемы	
Короткого (8 ч)	2 г	По 1г 5 раз в день	По 1 г 4-6 раз в день
Среднего (8-16 ч)	2 г	По 1г 3 раза в день	По 1 г 3 раза в день
Длительного (24-48 ч)	1-2г	-	По 1 г 1 раз в день



НИТРОФУРАН

Ы

— группа антибактериальных средств (впервые описаны в 1944 г). Они составляют второй после сульфаниламидов класс синтетических антибактериальных препаратов.

Производные нитрофурана: Фуразолидон, Нитрофурантоин (Фурадонин), Фуразидин (Фурагин), Нифуратель (Макмирор).

Они уступают по клинической эффективности большинству антибиотиков и имеют значение главным образом при лечении острых неосложненных форм инфекции.

Препараты **имеют широкий спектр**, действуют на ГР+ и ГР- микроорганизмы, включая сальмонеллы, простейшие (трихомонады, лямблии), хламидии, анаэробы.

Механизм действия

нарушают процесс клеточного дыхания бактерий, ингибируют биосинтез нуклеиновых кислот.

В зависимости от концентрации оказывают **бактериостатический** или **бактерицидный** эффект.



НИТРОФУРАНЫ

Привыкание микроорганизмов к нитрофуранам **не возникает**.
Препараты **не подавляют иммунные свойства организма**, снижают продукцию микроорганизмами токсинов; благодаря высокому содержанию в лимфе препятствуют распространению инфекции.

Нежелательные реакции

ЖКТ: тошнота, рвота, диарея.

Печень: нарушение функции, холестааз, гепатит.

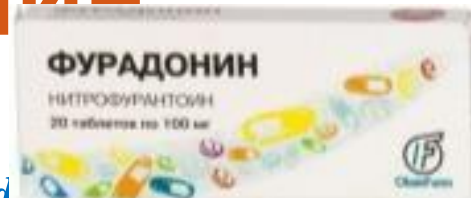
Аллергические реакции: сыпь, эозинофилия, лихорадка, артралгия, миалгия, волчаночноподобный синдром, редко - анафилактический шок.

Легкие: пневмонит (при приеме нитрофурантоина), бронхоспазм, кашель, боль в грудной клетке.

Нервная система: головокружение, головная боль, общая слабость, сонливость, периферические полинейропатии.



НИТРОФУРАНЫ ПРИМЕНЕНИЕ



- Местно: *нитрофурант (фурацилин), фуразидин (фурагин), фуразолидон.*
- При **кишечных инфекциях** (дизентерия, брюшной тиф, паратифы, пищевые токсикоинфекции и др.) применяют (внутрь) *фуразолидон*, который наиболее активен в отношении грамотрицательных бактерий, лямблий и трихомонад. Он хорошо всасывается, проникает в ткани и выделяется с желчью и секретом кишечных желез.
- При **инфекциях мочевыводящих путей** используют *Нитрофурантоин (фурадонин)* и *фуразидин (фурагин)*, так как они быстро резорбируются и выделяются с мочой, создавая высокую концентрацию в почках.
- Растворимый фурагин (солафур) может применяться при генерализованных инфекциях (**сепсис**, раневая инфекция и др.).



Лекарственные взаимодействия

- Активность нитрофурантоина и фуразидина **уменьшается под влиянием хинолонов.**
- При сочетании с **хлорамфениколом** (левомицетином) увеличивается риск угнетения кроветворения.
- При совместном применении с **алкоголем** фуразолидон может вызывать дисульфирамоподобную реакцию.
- При одновременном применении фуразолидона, являющегося ингибитором MAO, с другими ингибиторами MAO, симпатомиметиками, трициклическими антидепрессантами или пищевыми продуктами, содержащими тирамин, возникает риск развития **гипертонического криза.**



Информация для пациентов

- Принимать внутри после еды, запивать достаточным количеством воды (100-200 мл).
- Строго **соблюдать режим и схему лечения** в течение всего курса терапии, не пропускать дозу и принимать ее через равные промежутки времени. В случае пропуска дозы принять ее как можно скорее; не принимать, если почти наступило время приема следующей дозы; не удваивать дозу.
Выдерживать длительность терапии, особенно при стрептококковых инфекциях.
- Проконсультироваться с врачом, если улучшение не наступает в течение нескольких дней или появляются новые симптомы.
- **Не употреблять алкогольные напитки** во время терапии фуразолидоном и в течение 4 дней после ее отмены.
- Во время терапии фуразолидоном **не следует употреблять** в большом количестве продукты и напитки, содержащие тирамин (**сыр, пиво, вино, фасоль, копчености**).
- Во время лечения фуразолидоном **не следует** без назначения врача **принимать препараты для лечения кашля и простуды**.
- Соблюдать осторожность при головокружении.
- Нитрофурантоин и фуразидин **могут окрашивать мочу в ржаво-желтый или коричневатый цвет.**



НИТРОИМИДАЗОЛЫ

Производные нитроимидазола: **Метронидазол** (Трихопол),
Тинидазол (Фазижин), Орнидазол

синтетические антимикробные препараты с высокой активностью в отношении анаэробных бактерий и возбудителей протозойных инфекций.
Первый препарат группы - **метронидазол** - был разрешен для медицинского применения в 1960 г.

Показания к применению: амебиаз, трихомонадный кольпит, уретрит, лямблиоз, *Helicobacter pylori* при язве ЖКТ

Механизм действия.

- Убивают бактерии, которые способны восстанавливать нитрогруппу.
- В результате **нарушается репликация ДНК и синтез белка в микробной клетке, ингибируется тканевое дыхание**



НИТРОИМИДАЗОЛЫ

Фармакокинетика.

При приеме **внутрь** хорошо всасываются, **биодоступность** составляет более **80%** и не зависит от пищи.

Хорошо всасывается при интравагинальном введении в виде таблеток. Пиковые концентрации в крови в этом случае составляют примерно 50% тех, которые достигаются при приеме эквивалентной дозы внутрь. При использовании вагинального геля абсорбция значительно ниже.

При наружном применении метронидазол практически не всасывается.

Нитроимидазолы **метаболизируются в печени** с образованием активных и неактивных метаболитов.

Медленно выводятся из организма, с мочой - 60-80% принятой дозы, примерно 20% в неизмененном виде, с калом - до 15%.

При повторных введениях возможна **кумуляция**.

Период полувыведения в зависимости от препарата составляет от 6 ч (метронидазол) до 20 ч (секнидазол); у новорожденных может возрасти.



Побочные эффекты нитроимидазолов

Нитроимидазолы являются достаточно **низкотоксичными препаратами** и при правильном дозировании побочные эффекты возникают редко

- диспепсические расстройства;
- со стороны ЦНС головная боль, головокружение, сонливость, депрессия, нарушение координации;
- аллергические реакции;
- редко нейтропения, эпилептиформные судороги, псевдомембранозный колит;

Противопоказания.

Нитроимидазолы противопоказаны больным с нарушением кроветворения и прогрессирующими заболеваниями ЦНС.



МЕТРОНИДАЗОЛ (METRONIDAZOLUM)

Фарм. действие - противомикробное, антибактериальное, противопротозойное, трихомонацидное, противоязвенное, антиалкогольное.

Показания к применению: *Helicobacter pylori*, амёбная дизентерия, трихомонадоз, дизентерия инфузорная, протозойной инвазии

Способ применения и дозы. *Внутрь, в/в, интравагинально, наружно.*

Формы выпуска:

- *таблетки 0,25,*
- *крем 1%*
- *свечи внутривагинальных по 0,125г, 0,25г, 0,5г*
- *0,5% зеленоватого раствора для инъекций*



ТРИХОПОЛ (TRICHOPOLO)

Фармакологическое действие.

Противотрихомонадное средство

Показания к применению. Острый и хронический трихомониаз у женщин и мужчин.

Способ применения и дозы. Внутрь по 0,25 г 2 раза в день в течение 7—10 дней. Иногда первые 3—4 дня назначают по 0,25 г 3 раза в день. Общая доза на курс лечения 5 г.

Побочное действие. Диспептические явления, сухость во рту, потеря аппетита; иногда лейкопения. В отдельных случаях избыточное развитие грибковой флоры влагалища, что требует одновременного назначения нистатина.

Форма выпуска. Таблетки по 0,25 г, в упаковке 20 штук.



ТИНИДАЗОЛ (TINIDAZOLUM)

Фарм. действие. Препарат подавляет развитие *Trichomonas vaginalis*, *Entamoeba histolytica* лямблий
показанию . Острый и хронический трихомоноз у женщин и мужчин.

Применение: *внутри* 2 г в сутки

Форма выпуска. Таблетки по 0,5 г, в упаковке 4 штуки



ОРНИДАЗОЛ (Ornidazole) (син.Тиберал)

Фармакологическое действие. Противопрозоидное средство, подавляет развитие *Trichomonas vaginalis*, *Entamoeba histolytica* лямблий

Показания к применению. Трихомониаз, амебиаз (кишечные и некишечные формы, включая амёбную дизентерию и амёбный абсцесс печени), лямблиоз, профилактика послеоперационных осложнений (особенно при операциях на ободочной кишке или в гинекологии).

Применение: *внутри* в сочетании с вагинальными таб 1-2 приема

Форма выпуска. Таблетки по 500 мг



ФТОРХИНОЛОНЫ

ФТОРХИНОЛОНЫ – фторированные производные хинолона, действуют бактерицидно, на ГР+ и ГР- бактерии; активны в отношении синегнойной палочки.

Хинолоны классифицируют по времени введения в практику новых препаратов с улучшенными антимикробными свойствами.

Хинолоны разделяют на четыре поколения.

Классификация хинолонов

I поколение - нефторированные	II поколение - «грамотрицательные»	III поколение - «респираторные»	IV поколение - «респираторные»+ «антианаэробные»
<u>Налидиксовая кислота</u> (невиграмон)	<u>Ципрофлоксацин</u> <u>Ломефлоксацин</u>	Спарфлоксацин <u>Левифлоксацин</u>	<u>Моксифлоксацин</u>



ХИНОЛОНЫ I

ПОКОЛЕНИЯ

НАЛИДИКСОВАЯ КИСЛОТА

(Acidum Nalidixicum) *Невиграмон, Неграм*

Фармакокинетика: Хорошо всасывается в ЖКТ, особенно хуже переносится.

Высокие концентрации создаются только в моче. $T_{1/2}$ - 1-1,5 ч.

Спектр активности: Гр(-) палочки: E.coli, шигеллы, сальмонеллы, протей, клебсиеллы. Синегнойная палочка, ГР+ кокки и анаэробы устойчивы.

Нежелательные реакции: Диспепсические расстройства. Цитопении. Гемолитическая анемия. Возбуждение ЦНС. Холестаз.

Лекарственные взаимодействия Нельзя сочетать с нитрофуранами. **Показания.**

Инфекции МВП у детей, Шигеллез у детей. У взрослых при этих заболеваниях лучше применять фторхинолоны.

Предупреждение Ввиду того, что в ткани почек создается низкая концентрация препарата, его не рекомендуется применять при остром пиелонефрите.

Противопоказания Почечная недостаточность.

Дозировка

Взрослые Внутрь - по 0,5-1,0 г каждые 6 ч после еды.

Формы выпуска Таблетки и капсулы по 0,5 г.



ФТОРХИНОЛЫ

По фармакодинамике:

□ более широкий спектр активности, включающий:

- стафилококки (в том числе PRSA);
- ГР- кокки (гонококк, менингококк, *M. catarrhalis*);
- ГР+ палочки (листерии, коринебактерии, возб. сибирской язвы);
- ГР+ палочки семейства *Enterobacteriaceae*, включая полирезистентные (*E. coli*, сальмонеллы, шигеллы, протеи, энтеробактеры и др.)

□ отдельные препараты (**ципрофлоксацин**, офлоксацин, ломефлоксацин и др.) активны против *туберкулеза*;

□ действуют на некоторые внутриклеточные микроорганизмы (легионеллы).

По фармакокинетике:

○ создают высокие концентрации в крови и тканях **при приеме внутрь**, причем биодоступность не зависит от времени приёма пищи;

○ хорошо проникают в различные органы и ткани: легкие, почки, простату;

○ имеют длительный $T_{1/2}$, назначаются 1-2 раза в день.

По переносимости:

- нежелательные реакции со стороны ЖКТ и ЦНС встречаются реже;
- могут быть использованы при почечной недостаточности.



ФТОРХИНОЛОНЫ

II поколение (с начала 80-х годов),

- широким спектром антимикробного действия, включая стафилококки, высокой бактерицидной активностью
- хорошая фармакокинетикой, что позволяет применять их для лечения инфекций различной локализации.

III-IV поколение (с середины 90-х годов)

- высокая активностью в отношении ГР+ (прежде всего пневмококков), внутриклеточных патогенов, анаэробов (IV поколение), а также еще более оптимизированной фармакокинетикой.



ЦИПРОФЛОКСАЦ ИН

Является «золотым стандартом» среди фторхинолонов.

Хорошо всасывается в ЖКТ, биодоступность - 80%. $T_{1/2}$ - 4-6 ч.

Спектр активности, лекарственные взаимодействия - см. общие.

Показания Инфекции **органов дыхания** (обострение хронического бронхита, нозокомиальная пневмония).

Инфекции **МВП**. Простатит. Интраабдоминальные и тазовые инфекции. Кишечные инфекции. Тяжёлые инфекции кожи, мягких тканей, костей, суставов. Сепсис. Гонорея. Туберкулёз (препарат II ряда). Сибирская язва (лечение и профилактика).

Способ введения

Внутрь - по 0,5-0,75 г каждые 12 ч независимо от еды.

В/в капельно по 0,4-0,6 г каждые 12 ч (**нельзя вводить струйно**).

Формы выпуска Таблетки по 0,25 г, 0,5 г и 0,75 г; флаконы (ампулы) раствором для инфузий по 0,2 г и 0,4 г; глазные капли



ЛЕВОФЛОКСА ЦИН

Отличительным свойством является более высокая активность против пневмококков (включая пенициллинорезистентные штаммы), микоплазм хламидий.

Имеет высокую биодоступность при приеме внутрь - около 100%. $T_{1/2}$ - 6

Показания

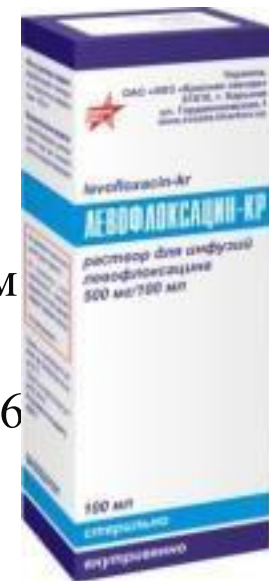
Инфекции ВДП (острый синусит). Инфекции НДП (обострение хронического бронхита, внебольничная пневмония). Инфекции МВП. Инфекции кожи и мягких тканей (лечение и профилактика).

Дозировка

Внутрь и внутривенно (медленно) - 0,5 г один раз в день независимо

Формы выпуска

Таблетки по 0,25 г и 0,5 г; флаконы с раствором для инфузий по 0,



СПАРФЛОКСАЦИН (SPARFLOXACIN)

Фторхинололы III поколения.

Показания к применению.

- Инфекции дыхательных путей и ЛОР-органов (в т.ч. пневмония, обострение ХОБЛ, отит, синусит);
- ЗППП (гонорея, хламидиоз);
- инфекции ЖКТ, вызванные шигеллами и сальмонеллами;
- инфекции почек и мочевыводящих путей (уретрит, цистит, пиелит);
- инфекции кожи и мягких тканей (инфицированные раны, абсцесс, пиодермия, фурункулез, инфекционный дерматит);
- хирургические инфекции.

Способ применения и дозы. Внутрь

Форма выпуска. Блистер, содержащий 6 таблеток (200 мг), покрытых оболочкой



МОКСИФЛОКСАЦИ Н



Превосходит хинолоны II поколения по активности против пневмококков (включая штаммы, устойчивые к пенициллину и макролидам) и атипичных патогенов (хламидии, микоплазмы).

В отличие от всех других фторхинолонов хорошо действует на неспорообразующие анаэробы, в том числе на *B.fragilis*.

Биодоступность при приеме внутрь - 90%. $T_{1/2}$ - 12-13 ч.

Показания. Инфекции ВДП (острый синусит).

Инфекции НДП (обострение хронического бронхита, внебольничная пневмония). Инфекции кожи и мягких тканей.

Дозировка

Взрослые. Внутрь - 0,4 г один раз в день независимо от приёма пищи.

Форма выпуска

Таблетки по 0,4 г.



ПРОИЗВОДНЫЕ ХИНОКСАЛИНА

- Механизм действия – активируют ПОЛ, что нарушает синтез ДНК и приводит к деструкции компонентов цитоплазмы, в анаэробной среде их эффективность повышается за счет продукции активных форм кислорода.
- Вид действия – бактерицидный.
- Спектр действия – широкий: Грам(+) и Грам(-)-бактерии, вкл. метициллинрезистентные стафилококки, протей, синегнойную палочку и анаэробы.
- Препараты: **хиноксидин** (принимают внутрь), **диоксидин** (инъекционная форма) являются препаратами резерва при тяжелых гнойно-воспалительных заболеваниях при неэффективности прочих противомикробных средств.
- Препараты токсичны, назначаются только взрослым; побочные эффекты: диспепсия, головная боль, головокружение, судороги



ПРОИЗВОДНЫЕ 8-ОКСИХИНОЛИНА

- Механизм действия – угнетение синтеза ДНК и мембранотоксическое действие.
- Вид действия – бактерицидный.
- Спектр действия – широкий: Грам(+) и Грам(-)-бактерии, простейшие, кандиды.
- Препараты: **хлорхинальдон**, **хиниофон** – не всасываются из ЖКТ, применяются при амебиазе, кишечных инфекциях, лямблиозе (только хлорхинальдон); **нитроксолин** (5-НОК) – наиболее активен в отношении Грам(-)-флоры, на простейших не действует, быстро всасывается из кишечника и сразу выводится почками, вследствие чего в моче создается высокая концентрация препарата; применяется при инфекциях мочевыделительных путей.
- Побочные эффекты: диспепсия, аллергия; при всасывании препаратов – головная боль, головокружение, полинейропатия, заторможенность, тахикардия, поражение зрительного нерва (кроме нитроксолина)



ОКСАЛИДИНДИНОНЫ

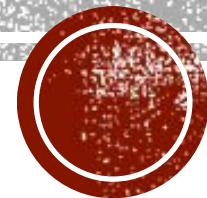
- Механизм действия – угнетение синтеза белка.
- Вид действия – бактериостатический.
- Спектр действия – узкий: Грам(+)-бактерии.
- Биодоступность – 100 %.
- Нет перекрестной резистентности с другими антибиотиками, нарушающими синтез белка.
- Резистентность к препарату развивается очень медленно.
- Применяется при госпитальной и внебольничной пневмонии, инфекциях, вызванных ванкомицинрезистентными энтерококками, инфекциях кожи и мягких тканей.
- Препарат: **линезолид**. Хорошо переносится; является ингибитором MAO. Побочные эффекты: аллергические реакции, диспепсия.



ПРИНЦИП ДЕЙСТВИЯ РЯДА СИНТЕТИЧЕСКИХ СРЕДСТВ



ПРОТИВОТУБЕРКУЛЕЗНЫЕ,
ПРОТИВОГРИБКОВЫЕ,
ПРОТИВОВИРУСНЫЕ И
ПРОТИВОХЛАМИДИЙНЫЕ
ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА
ЛЕКЦИЯ 9

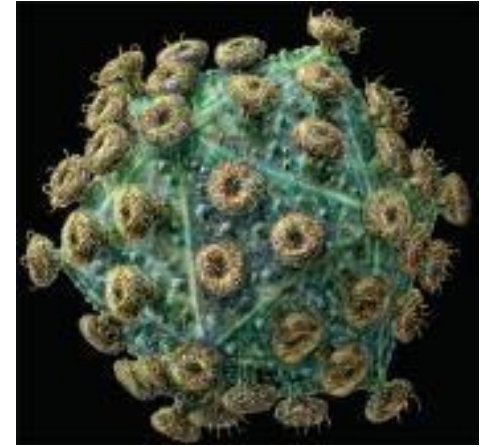


ПРОТИВОВИРУСНЫЕ СРЕДСТВА

Вирусы (от лат. virus, яд) - наименьшие по размерам инфекционные агенты, состоящие из нуклеиновой кислоты (ДНК или РНК), структурных белков и ферментов.

Вирусные заболевания (наиболее известны):

- герпетические инфекции,
 - аденовирусные инфекции,
 - гепатит В,
 - грипп и парагриппозные заболевания,
 - оспа,
 - бешенство,
 - энцефалиты и менингиты (полиомиелит, гепатит А, гастроэнтериты и др.),
 - СПИД
- и другие заболевания.



Вирус иммунодефицита человека



ИНТЕРФЕРОНЫ – ЭТО ОСОБАЯ ГРУППА БЕЛКОВ, КОТОРЫЕ ПРОДУЦИРУЮТСЯ КЛЕТКАМИ ИММУННОЙ СИСТЕМЫ БОЛЬШИНСТВА ЖИВОТНЫХ И ЧЕЛОВЕКА.

Интерфероны – это вид оружия при помощи которого мы может противостоять болезнетворным бактериям, паразитам и даже раковым клеткам.

Интерфероны обладают антивирусным и противоопухолевым действием, но что важнее, обладают свойством активировать – понуждать к действию такие клетки иммунной системы как макрофаги.

Существует три основных класса:

- **Интерферон - α (альфа)** выделяется белыми кровяными клетками (лимфоцитами Т и В).
- **Интерферон - β (бета)** выделяется фибробластами,
- **интерферон - ω (омега)** продуцируется Т-клетками и естественными киллерами.



ПРОТИВОВИРУСНЫЕ СРЕДСТВА

Классификация средств для лечения и профилактики

ОРВИ: а) *индукторы интерферона:* Арбидол, Кагоцел, Анаферон, Амиксин;

б) *препараты интерферона:*

1 поколение: **человеческий лейкоцитарный интерферон;** 2

поколение: **Интерферон Альфа-2А (Реаферон), Виферон, Гриппферон;**

в) *противовирусные химиопрепараты:*

-ингибиторы нейраминидазы: **Осельтамивир (Тамифлю), Занамивир (Реленза);**

-блокаторы ионных M_2 -каналов вируса гриппа типа А:
Римантадин.

Противогерпетические средства: Ацикловир (Зовиракс), Валацикловир (Валтрекс), Пенцикловир, Фамцикловир (Фамвир)



ОСНОВНЫЕ МЕХАНИЗМЫ ДЕЙСТВИЯ ПРОТИВОВИРУСНЫХ ПРЕПАРАТОВ

На стадии заражения вирус адсорбируется на клеточной мембране и проникает в клетку. В этот период применяются **препараты, нарушающие этот процесс**: растворимые ложные рецепторы, антитела к мембранным рецепторам, ингибиторы слияния вируса с клеточной мембраной.

На стадии пенетрации вируса, когда происходит депротеинизация вириона и «раздевание» нуклеопротеида, эффективны блокаторы ионных каналов и стабилизаторы капсида.

На следующем этапе начинается внутриклеточный синтез вирусных компонентов. На этом этапе эффективны **ингибиторы вирусных ДНК-полимераз, РНК-полимераз**, обратной транскриптазы, геликазы, праймазы, интегразы. На трансляцию вирусных белков действуют интерфероны (ИФН), антисмысловые олигонуклеотиды, рибозимы и ингибиторы регуляторных белков. На протеолитическое расщепление воздействуют ингибиторы протазы. ИФН и ингибиторы структурных белков активно воздействует на сборку вируса.

Заключительный этап репликационного цикла включает выход дочерних вирионов из клетки и гибель инфицированной клетки-хозяина. На этом этапе





Схема репликации вирусов и механизм действия противовирусных препаратов.



ИНДУКТОРЫ ИНТЕРФЕРОНА

это ЛС, обладающие широким спектром противовирусной активности, *активирующие синтез эндогенных интерферонов* в различных органах и тканях (крови, кишечнике, печени, головном мозге, лимфоидных органах) и оказывающие иммуномодулирующее действие.

Механизм действия:

**ингибиторы вирусных ДНК-полимераз,
РНК- полимераза**



КАГОЦЕЛ

Показания. Грипп, ОРВИ, герпес.

Способ применения и дозы. Внутрь. Для лечения гриппа и ОРВИ: в первые 2 дня — 2 таблетки 3 раза в день, в

последующие 2 дня — 1 таблетка 3 раза в день. Курсовая доза — 18 таблеток, курс лечения — 4 дня.



АРБИДОЛ

Показания. Профилактика и лечение гриппа, ОРВИ. Для профилактики - по 2 таблетки (0,2 г) в сутки

Способ применения и дозы. Назначают внутрь до еды.

- по 0,1г 1 раз в сутки каждые 3—4 дня в течение

АНАФЕРОН **Показания.** Профилактика и лечение гриппа, ОРВИ.

Способ применения и дозы. Внутрь на один прием

- 1 таблетку (держат в рту до полного



АМИКСИН

Активное в-во ТИЛОРОН

Фарм.действие. Низкомолекулярный синтетический индуктор интерферона, стимулирующий образование в организме интерферонов альфа, бета, гамма.

Тилорон не подвергается биотрансформации и не кумулирует в организме. Выводится практически в неизмененном виде с калом (около 70%) и мочой (около 9%). $T_{1/2}$ составляет 48 ч.

Способ применения: Препарат принимают внутрь после еды. Для профилактики - 1 раз в неделю 6 недель. Для лечения вирусных гепатитов – 2 раза в сутки, при ОРВИ и гриппа – 1 раз в сутки.

Форма выпуска: в 2 дозировках: для детей 60 мг, и для взрослых 125 мг.

Средство нельзя принимать беременным женщинам и в период вскармливания ребенка грудью.



ПРЕПАРАТЫ ИНТЕРФЕРОНА – 1 ПОКОЛЕНИЕ

ИНТЕРФЕРОН ЧЕЛОВЕЧЕСКИЙ ЛЕЙКОЦИТАРНЫЙ

Показания к применению. Профилактика и лечение гриппа и других ОРВИ.

Способ применения и дозы.

Препарат вводят интраназально путем **закапывания** водного раствора или ингаляций. Содержимое **ампулы** растворяют в 2мл кипяченой охлажденной воды.



ПРЕПАРАТЫ ИНТЕРФЕРОНА – 2 ПОКОЛЕНИЕ

ИНТЕРФЕРОН АЛЬФА-2А

Показания к применению. Гепатит В, лейкемия, саркома Капоши, рак почки, мочевого пузыря, меланома, опоясывающий лишай.

Способ применения. в/м и п/к в зависимости от заболевания от 3х раз в неделю до 1 раза в день. Минимальная продолжительность терапии 6 месяцев.

Побочные действия. Гипертермия, вялость, лихорадка, озноб, потеря аппетита и т.д.
Форма выпуска. Порошок для инъекций или раствор



ПРЕПАРАТЫ ИНТЕРФЕРОНА – 2

ПОКОЛЕНИЕ

■ ВИФЕРОН (Viferon)

Препарат человеческого рекомбинантного интерферона альфа-2b

Фармакологическое действие.

Усиливает активность Т- и В-лимфоцитов, нормализует иммунный статус. Уровень интерферона в сыворотке крови снижается через 12 ч. после ректального введения, что обуславливает необходимость повторного введения.

Показания к применению. Вирусные и бактериальные инфекции.

Способ применения. Ректально. Наружно, местно.

Побочных действий: не выявлено

Форма выпуска. Мазь или гель. Суппозитории ректальные.



ПРЕПАРАТЫ ИНТЕРФЕРОНА – 2 ПОКОЛЕНИЕ

■ ГРИППФЕРОН (Grippferon)

Рекомбинантный альфа-2b человеческий интерферон

Показания к применению. Профилактика и лечение гриппа и ОРВИ у детей от рождения и взрослых, включая беременных женщин.

Способ применения. Интраназально.

После закапывания рекомендуется помассировать пальцами крылья носа в течение нескольких минут для равномерного распределения препарата в носовой полости. **Форма выпуска.** Во флаконах-капельницах и спрей



ИНГИБИТОРЫ НЕЙРАМИНИДАЗЫ

Механизм действия: **проникают внутрь вируса.** Они подавляют активность патогенных микроорганизмов, предотвращая их последующее размножение и контакт со здоровыми клетками.

Применяются для профилактики и лечения гриппа разных штаммов. Продаются ингибиторы нейраминидазы только по назначению врача. Также допускается использование медикаментов в условиях стационара по показаниям. Не рекомендуется принимать такие лекарства беременным женщинам и кормящим матерям. Противопоказанием к применению будет детский возраст до 5 лет.

Осельтамивир (Тамифлю),

у взрослых и детей после 12 лет - 2 раза в сутки по 1 таблетке. Курс 5 дней. Для детей от 5 до 12 лет - суспензия 30-75 мг (в зависимости от массы тела) 2 р. в сутки

Занамивир (Реленза)

Применяется ингаляционно: по 10 мг вещества (2 ингаляции) дважды в день. Продолжается терапия 5 суток. Для профилактики используется 10 мг препарата один раз в сутки протяжении 10 дней.



БЛОКАТОРЫ ИОННЫХ M_2 -КАНАЛОВ ВИРУСА ГРИППА ТИПА А

■ РИМАНТАДИН (Remantadinum)



Показания к применению.

Лечение в начальной стадии

(1-2 дня) гриппа и профилактика гриппа и ОРВИ в период эпидемии гриппа.

Способ применения и дозы. Внутрь после еды. В 1-й день — по 2 таблетки (100 мг) 3 раза в сутки, на 2 -й и 3-й день — по 1—2 таблетки 3 раза в сутки.

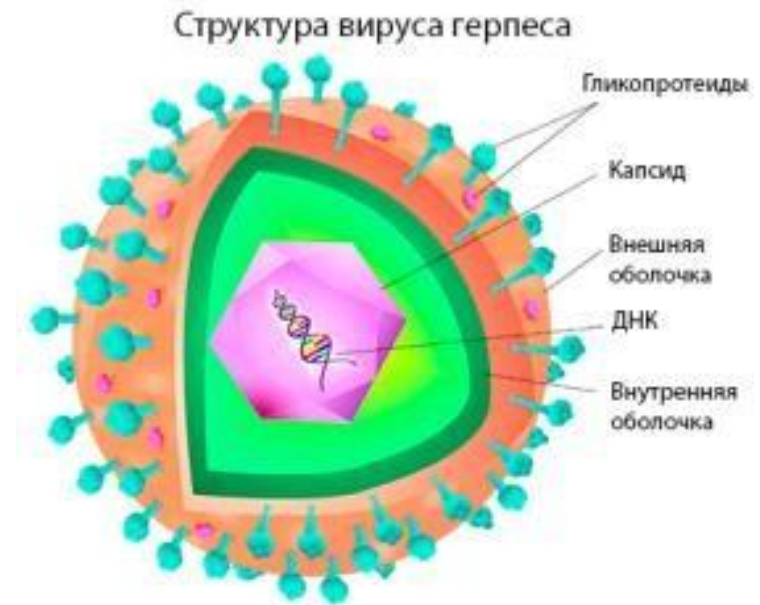
Форма выпуска. Таблетки по 0,05 г (50 мг),



ПРОТИВОГЕРПЕТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

Механизм действия. Блокируют синтез ДНК у размножающихся вирусов герпеса, а именно ДНК-полимеразы, но не действуют на вирусы, находящиеся в латентном состоянии.

- Ацикловир (Зовиракс),
- Валацикловир (Валтрекс),
- Пенцикловир,
- Фамцикловир (Фамвир)



ПРОТИВОГЕРПЕТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

Ацикловир является родоначальником оказывает активный метаболит ацикловира - **ацикловира трифосфат**, который образуется в клетках, пораженных вирусом **герпеса**. Ингибируя вирусную ДНК-полимеразу, **ацикловира трифосфат** блокирует синтез вирусной ДНК. Обладает очень низкой токсичностью, т.к. не действует на ДНК-полимеразу клеток человека и неактивен в здоровых клетках.

Ацикловир, валацикловир и фамцикловир при приеме внутрь имеют сравнимую клиническую эффективность.

Пенцикловир в пораженных вирусом клетках превращается в **пенцикловира трифосфат**, который нарушает синтез вирусной ДНК.

Пенцикловир имеет более длительный период полувыведения из клетки (7–20 ч), чем у ацикловира (менее 1 ч), но он обладает меньшим сродством к вирусной ДНК-полимеразе, т.е. менее активен.

Причем **валацикловир и фамцикловир** представляют собой исходно неактивные соединения (пролекарства), которые в организме человека превращаются в **ацикловир и пенцикловир**, соответственно.



ПРОТИВОГЕРПЕТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

Ацикловир,

Способ применения: внутрь, в/в, местно

Форма выпуска: таблетки, капсулы и 4% суспензия для приема внутрь, лиофилизированный порошок для приготовления р-ра для инъекций, 5% мазь и крем, 3% глазная мазь.

• **Валацикловир**, Способ применения: внутрь. Форма выпуска: таблетки

• **Пенцикловир**,

Способ применения: местно Форма выпуска: 1% крем

• **Фамцикловир** Способ применения: внутрь. Форма выпуска: таблетки

• **Герпенокс (модифицированная молекула ацикловира)**

Способ применения: местно. Форма выпуска:



ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА

ПРОТИВ COVID-19

Ремдизивир (США)

снижает среднюю продолжительность
заболевания с 15 дней до 11

Авифавир (Фавипиравир) (РФ) 2 раза снижается
продолжительность болезни. мешают вирусу
делиться внутри клетки.

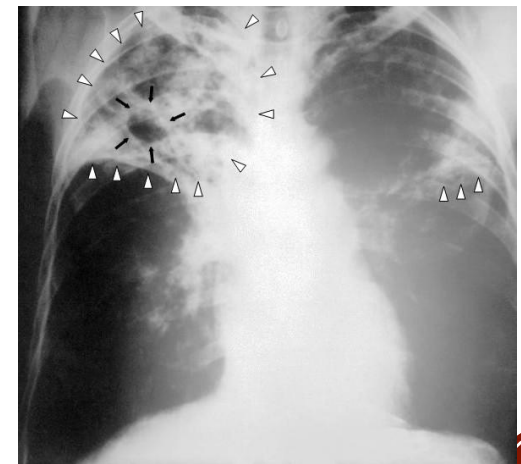


ПРОТИВОТУБЕРКУЛЕЗНЫЕ СРЕДСТВА

Туберкулез – хроническое рецидивирующее инфекционное заболевание, вызываемое *M. tuberculosis* и другими близкородственными видами.

Основные принципы терапии:

1. Этапность: первый этап – интенсивная терапия с целью уменьшения бактериальной популяции; второй этап – долечивание с целью воздействия на оставшиеся бактерии, находящихся в большинстве случаев внутриклеточно в виде персистирующих форм.
2. Комбинированная терапия
3. Контроль за приемом препаратов
4. Профилактика развития побочных Эффектов.



ПРОТИВОТУБЕРКУЛЕЗНЫЕ СРЕДСТВА

Для терапии туберкулеза используются антибиотики и синтетические препараты.

По эффективности препараты подразделяются:

1. Наиболее эффективные: изониазид, рифампицин
2. Средней эффективности: стрептомицин, амикацин, флоримицин, пиразинамид, этамбутол, протионамид
3. Умеренно эффективные: ПАСК, изоацетазон

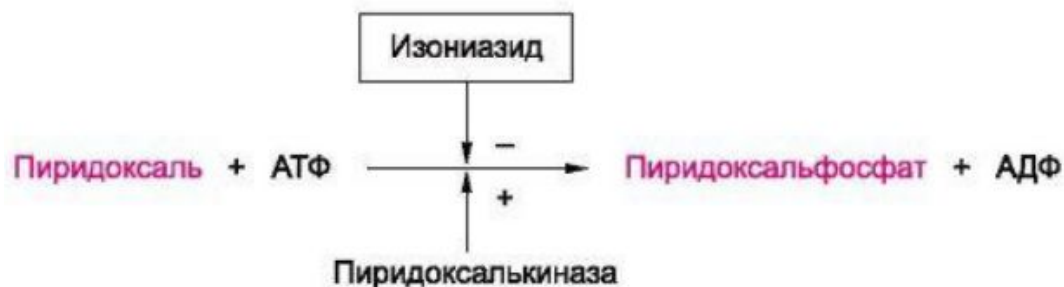


ПРОТИВОТУБЕРКУЛЕЗНЫЕ СРЕДСТВА

Синтетические средства активны только в отношении микобактерий туберкулеза и возбудителя лепры (изониазид, этионамид) или только микобактерий туберкулеза (этамбутол):

Изониазид (Isoniazidum, табл. по 100, 200 и 300 мг; 10 % р-р в амп.):

- угнетает синтез миколовых кислоты (структурный компонент клеточной стенки бактерий);
- бактерицидное действие при внеклеточном расположении бактерий, бактериостатическое – при внутриклеточном;
- применяют при любых формах туберкулеза;
- вызывает угнетение образования пиридоксальфосфата и связанные с ним нейропатии; кроме этого побочные эффекты – аллергия, поражения печени, энцефалопатия.



ПРОТИВОТУБЕРКУЛЕЗНЫЕ СРЕДСТВА

Этамбутол:

- угнетает синтез РНК и белка, нарушает липидный обмен в клетке;
- бактериостатик;
- применяют при всех формах туберкулеза;
- побочные эффекты – ухудшение зрения, диспептические явления, увеличение количества мокроты, неврит, головная боль.

Этионамид:

- угнетает пептидов микобактерий;
- бактериостатик: действует на микобактерии, расположенные внутри- и внеклеточно;
- к нему быстро развивается резистентность;
- усиливает фагоцитоз в очаге туберкулезного воспаления, что способствует его рассасыванию;
- побочные эффекты – раздражающее действие, поражение печени, неврит зрительного нерва, тромбоцитопения, гиповитаминоз В₆, тромбоцитопения, аллергия.



КОМБИНИРОВАННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

На основе противотуберкулёзных средств I ряда - **изониазида, рифампицина, пиразинамида, этмбутола** - создан ряд комбинированных таблетированных препаратов, таких как **рифинаг, рифатер, рифакомб, майрин, майрин П, фтизоэтам, фтизопирам**. Главная цель разработки и применения этих препаратов - сокращение суточного числа таблеток, принимаемых пациентом, и обеспечение на этой основе более высокой комплаентности.

Дозы компонентов, включенных в комбинированные препараты, соответствуют их суточным дозам, рекомендованным ВОЗ

Число компонентов	Торговое название	Компоненты
2-компонентные	<i>Рифинаг</i>	рифампицин 0,15 г + изониазид 0,1 г
		рифампицин 0,3 г + изониазид 0,15 г
	<i>Фтизоэтам</i>	изониазид 0,15 г + этамбутол 0,4
	<i>Фтизопирам</i>	изониазид 0,15 г + пиразинамид 0,5 г
3-компонентные	<i>Рифакомб</i>	рифампицин 0,15 г + изониазид 0,1 г + пиридоксин 0,1 г
	<i>Рифатер</i>	рифампицин 0,15 г + изониазид 0,05 г + пиразинамид 0,3 г
	<i>Майрин</i>	рифампицин 0,15 г + изониазид 0,075 г + этамбутол 0,3 г
4-компонентные	<i>Майрин П</i>	рифампицин 0,12 г + изониазид 0,06 г + этамбутол 0,225 г + пиразинамид 0,3 г



ПРОТИВОГРИБКОВЫЕ СРЕДСТВА

Микозы – заболевания, вызываемые патогенными или условно патогенными грибами.

Противогрибковые средства по клиническому применению делятся на препараты, применяемые при:

- системных микозах,
- дерматомикозах,
- кандидамикозах

К **системным микозам** относятся аспергиллез, криптококкоз, бластомикоз и гистоплазмоз, при которых поражаются внутренние органы и ЦНС.

К **дерматомикозам** относятся микроспория, трихофития и эпидермофития – грибковые поражения кожи и ее придатков.

Кандидамикоз вызывает условно-патогенный грибок рода *Candida*. Может иметь как поверхностную (слизистые оболочки ротовой полости, бронхов, ЖКТ, влагалища), так и системную локализацию (кандидамикоз легких, ЦНС, сепсис).



ПРОТИВОГРИБКОВЫЕ СРЕДСТВА

По химической структуре подразделяются на:

1) Антибиотики:

- полиеновые
- гризеофульвин

2) Синтетические средства:

- производные имидазола: кетоконазол, клотримазол, миконазол
- производные триазола: флуконазол, итраконазол
- производные N-метилнафтиламина: тербинафин
- производные ундециленовой кислоты: микосептин
- бис-четвертичные аммониевые соли: декамин



ПРОТИВОГРИБКОВЫЕ СРЕДСТВА

Антибиотики

1. Полиеновые антибиотики:

- механизм действия – препараты связываются с эргостерином и ситостеринами цитоплазматической мембраны грибов, что нарушает их проницаемость для ионов и гибель клетки;

- широкий противогрибковый спектр действия, на бактерии не действуют;

- фунгицидный вид действия;

- возможно взаимодействие в холестеринном мембран животных клеток, что является причиной развития побочных эффектов

- препараты:

а) **амфотерицин В** – ведущий препарат в терапии глубоких микозов, применяется только внутривенно (не всасывается в ЖКТ), очень токсичен.

б) **нистатин, леворин** – препараты местного действия, не всасываются в ЖКТ, применяются для терапии кандидамикозов слизистых оболочек рта, влагалища и кишечника



ПРОТИВОГРИБКОВЫЕ СРЕДСТВА

Антибиотики

2. **Гризеофульвин** отличается по структуре от полиеновых антибиотиков, продуцируется *Penicillium griseofulvum*:

- механизм действия – блокада деления грибов в метафазе;
- узкий противогрибковый спектр действия – дерматофиты;
- фунгистатический вид действия;
- применяется внутрь, хорошо всасывается из ЖКТ, особенно при приеме с жирной пищей; накапливается в тканях содержащих кератин;
- терапия длительная(до 12 месяцев): пока больная ткань не заменится на здоровую;
- побочное действие: нарушение функции ЦНС, гепатотоксичность, миелотоксичность, снижение неспецифического иммунитета, нарушение обмена витаминов группы В, «волчаночный» синдром



ПРОТИВОГРИБКОВЫЕ СРЕДСТВА

Синтетические противогрибковые средства

1. Препараты групп азолов: производные имидазола и триазола:

- механизм действия – блокада деметилазы, превращающей ланостерин в 14-деметилланостерил, нарушая в итоге образование входящего в состав клеточной мембраны эргостерина;
- широкий противогрибковый спектр действия;
- в малых дозах – фунгистатический, в больших – фунгицидный вид действия;
- препараты:
 - а) производные имидазола: **кетоконазол** – препарат резерва при глубоких микозах, высоко токсичен;
 - б) производные триазола: **флуконазол** – самый безопасный системный антимикотик, основное применение – кандидозы любой локализации; **итраконазол** – в основном используется для терапии онихомикозов, т.к. хорошо накапливается в тканях, содержащих кератин



ПРОТИВОГРИБКОВЫЕ СРЕДСТВА

Синтетические противогрибковые средства

2. Производные N-метилнафтиламина:

- механизм действия – блокада скваленэпоксидазы, что приводит к нарушению синтеза эргостерина; внутриклеточное накопление сквалена;
- широкий противогрибковый спектр действия в отношении грибов, вызывающих грибковую инфекцию кожи, волос и ногтей;
- фунгицидный вид действия;
- препарат: **тербинафин** применяется внутрь и местно;
- побочные эффекты носят кратковременный характер: при приеме внутрь – диспепсия, кожная сыпь; при применении наружных форм – гиперемия, зуд, ощущение жжения, аллергические реакции.



ПРОТИВОХЛАМИДИЙНЫЕ СРЕДСТВА

Chlamydia trachomatis — представляют собой неподвижные кокковидные грамотрицательные облигатные внутриклеточные микроорганизмы.

Хламидийная инфекция поражает главным образом мочеполовую систему.

У *Chlamydia trachomatis* разделяют следующие антигенные серотипы:

A, B, Ba, C — вызывают трахому;

D, E, F, G, H, I, J, K — вызывают конъюнктивит и урогенитальные инфекции;

L1, L2, L3 — вызывают венерическую лимфогранулему.



ПРОТИВОХЛАМИДИЙНЫЕ СРЕДСТВА

- Поскольку *Chlamydia trachomatis* — внутриклеточный паразит, выбор препаратов ограничивается теми, которые способны проникать внутрь клетки.
- Макролиды:
 - эритромицин,
 - олеандомицин,
 - кларитромицин,
 - рокситромицин;
 - азитромицин;
 - джозамицин
- Макролиды «нового поколения» незначительно отличаются от эритромицина по спектру действия, но имеют неполную перекрестную устойчивость с ним, улучшенную фармакокинетику и повышенный профиль безопасности.



ПРОТИВОСИФИЛИТИЧЕСКИЕ,
ПРОТИВОПРОТОЗОЙНЫЕ СРЕДСТВА
(ПРОТИВОЛЯМБЛИОЗНЫЕ,
ПРОТИВОТРИХОМОНАДНЫЕ),
ПРОТИВОГЛИСТНЫЕ ЛС
ЛЕКЦИЯ 10



ПРОТИВОСИФИЛИТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

Сифилис – хроническое венерическое заболевание, характеризующееся поражением кожи, слизистых оболочек, внутренних органов, костей и нервной системы.

Возбудитель – бледная трепонема (*Treponema pallidum*).

Терапия заболевания комплексная; в терапии используются антибиотики и синтетические средства:

I. Антибиотики:

- Препараты бензилпенициллина занимают основное место, действуют на всех стадиях заболевания: **бензилпенициллина натриевая и калиевая соли, бензилпенициллин прокаин, бициллин-1, бициллин-5;**

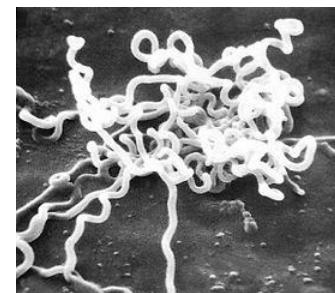
- Цефалоспорины: **цефалоридин, цефтриаксон;**

- Макролиды: эритромицин, азитромицин

II. Синтетические средства:

- Препараты висмута: **бийохинол, бисмоверол;**

- Препараты мышьяка: **миарсенол, осарсол.**



Протозойные инфекции или **протозоозы** – это инфекционные заболевания человека, вызываемые патогенными простейшими.

Протозойные инфекции:

- Малярия
- Амебиаз
- Лямблиоз
- Трихомонадоз
- Токсоплазмоз
- Балантадиаз
- Лейшманиоз

ПРОТИВОПРОТОЗОЙНЫЕ СРЕДСТВА

предназначены для лечения и профилактики заболеваний, вызванных возбудителями малярии, лейшманиоза, трипаносомоза, трихомоноза, амебиаза, хламидиоза, лямблиоза и др.

В качестве противопротозойных средств используют препараты

- растительного происхождения (алкалоиды эметин и **хинин**),
- некоторые антибиотики например, Доксициклин (см. тетрациклины полусинтетические),
- Амфотерицин В** (см. Макролиды),
- производные нитрофурана (см. Фуразолидон)
- Нитроимидазолы (см.**Метронидазол** (Трихопол), Орнидазол (Тиберал))

Противопротозойные средства:

Хлорохин (Делагил),
Гидроксихлорохин (Плаквенил),
Метронидазол (Трихопол),
Орнидазол (Тиберал),
Фуразолидон, Доксициклин.



КЛАССИФИКАЦИЯ

1. ЛС, применяемые для профилактики и лечения малярии (**Хингамин, Хинин, Хлоридин, Примахин, сульфаниламиды, тетрациклины**)
2. ЛС, применяемые при лечении амебиаза (**Метронидазол, Хиниофон, Эметина гидрохлорид, Хингамин, тетрациклины**)
3. ЛС, применяемые при лечении лямблиоза (**Метронидазол, Фуразолидон, Акрихин**)
4. ЛС, применяемые при лечении трихомоноза (**Метронидазол, Тинидазол, Трихомонацид, Фуразолидон**)



КЛАССИФИКАЦИЯ

5. ЛС, применяемые при лечении токсоплазмоза
(Хлоридин, сульфаниламиды)
6. ЛС, применяемые при лечении балантадиаза
(тетрациклины, Мономицин, Хиниофон)
7. ЛС, применяемые при лечении лейшманиоза
**(Солюсурьмин, Натрия стибоглюконат,
Метронидазол)**



ЛС, ПРИМЕНЯЕМЫЕ ПРИ ЛЕЧЕНИИ ЛЯМБЛИОЗА

Возбудителем лямблиоза является *Lambliа intestinalis*. Поражается кишечник, желчный пузырь, печень.

Для лечения лямблиоза применяют:

Метронидазол, Аминохинол, Фуразолидон.

Аминохинол

Формы выпуска: порошок; таблетки по 0,025; 0,05

Фуразолидон

Формы выпуска: таблетки по 0,05



ЛС, ПРИМЕНЯЕМЫЕ ПРИ ЛЕЧЕНИИ ТРИХОМОНАДОЗА

Трихомонадоз – острое или хроническое заболевание, вызываемое *Trichomonas vaginalis*. Поражаются различные отделы мочеполовой системы.

Препаратом выбора является **Метронидазол**.



МЕТРОНИДАЗОЛ (КЛИОН, ТРИХОПОЛ)

- Взаимодействует с неферментативными переносчиками электронов, которые восстанавливают нитрогруппу препарата → образуются свободные радикалы → взаимодействуют с ДНК, нарушают процессы транскрипции и редупликации
- Губительное действие на амебы, трихомонады, лямблии, неспорообразующие анаэробы
- «Тетурамоподобный» эффект
- Побочные эффекты: диспепсические явления (нарушение аппетита, металлический привкус во рту, тошнота, диарея); редко – нарушения со стороны ЦНС (тремор, нарушение координации); поражения кожи, слизистых оболочек



ПРОТИВОГЕЛЬМИНТНЫЕ (ПРОТИВОГЛИСТНЫЕ) СРЕДСТВА

Гельминтозы – болезни человека, животных, вызываемые паразитическими червями – гельминтами.

Широко распространены (в России встречается более 100 видов).

Человек может быть хозяином свыше 250 видов гельминтов.



ГЕЛЬМИНТОЗЫ

по возбудителю

- КРУГЛЫЕ ЧЕРВИ □ НЕМАТОДОЗЫ
- ЛЕНТОЧНЫЕ ЧЕРВИ □ ЦЕСТОДОЗЫ
- СОСАЛЬЩИКИ □ ТРЕМАТОДОЗЫ



ГЕЛЬМИНТОЗЫ

по локализации

- КИШЕЧНЫЕ

- НЕМАТОДОЗЫ

- ЦЕСТОДОЗЫ

- ВНЕКИШЕЧНЫЕ

- ТРЕМАТОДОЗЫ



ПРОТИВОГЛИСТНЫЕ СРЕДСТВА



ГЕЛЬМИНТОЗЫ



ДЕГЕЛЬМИНТИЗАЦИЯ



КЛАССИФИКАЦИЯ

По механизму действия:

1. Клеточные яды
2. ЛС, парализующие нервно-мышечную систему круглых червей (**Пиперазина адипинат, Дитразин, Левамизол, Нафтамон**)
3. ЛС, парализующие нервно-мышечную систему плоских червей и разрушающие их покровные ткани (**Фенасал**)
4. ЛС, действующие преимущественно на энергетические процессы гельминтов (**Мебендазол, Альбендазол**)



КЛАССИФИКАЦИЯ

По локализации действия:

1. Средства, применяемые при кишечных гельминтозах:

Левамизол, Празиквантель, Мебендазол, Альбендазол, Пирантела памоат, Нафтамон, Пиперазина адипинат, Фенасал

2. Средства, применяемые при внекишечных гельминтозах:

Празиквантель, Мебендазол, Альбендазол, Ивермектин, Дитразин, Хлоксил



ЛЕВАМИЗОЛ (ДЕКАРИС)

- Эффективен при аскаридозе, анкилостомидозе, стронгилоидозе и др.
- Парализует гладкую мускулатуру гельминтов, вызывает обездвиживание
- Не требуется соблюдение диеты и назначение слабительных средств
- Иммуностимулирующее действие
- Побочные эффекты: диспепсические расстройства, головная боль, изменения обоняния и вкуса

Форма выпуска: таблетки по 0,05; 0,15



ПРАЗИКВАНТЕЛЬ (БИЛЬТРИЦИД)

- Эффективен при шистосомозах, трематодозах, описторхозе, тениозе, тениаринхозе, дифиллоботриозе и др.
- Вызывает повышение проницаемости клеточных мембран паразитов для ионов кальция → сокращение мускулатуры → спастический паралич
- Побочные эффекты: головная боль, сонливость, диспепсические расстройства, повышенная потливость, лихорадка, кожные аллергические реакции

Форма выпуска: таблетки по 0,6



МЕБЕНДАЗОЛ (ВЕРМОКС)

- Высокоэффективное средство широкого спектра, наиболее эффективен при энтеробиозе, трихоцефалезе
- Избирательно нарушает синтез цитоплазматического тубулина гельминтов, угнетает усвоение гельминтами глюкозы, тормозит образование АТФ
- Не требуется соблюдение диеты и назначение слабительных средств
- Побочные эффекты: преходящие боли в животе, диарея, аллергические реакции

Форма выпуска: таблетки по 0,1



АЛЬБЕНДАЗОЛ

- Наиболее эффективен в отношении личиночных форм цестод и нематод
- Угнетает усвоение гельминтами глюкозы, тормозит образование АТФ
- Возможные побочные эффекты: головная боль, головокружение, диспепсические расстройства, нарушение функции печени и почек, угнетение кроветворения, повышение АД, алопеция, аллергические реакции

Форма выпуска: таблетки по 0,2



ПИРАНТЕЛА ПАМОАТ

- Эффективен при энтеробиозе, аскаридозе, анкилостомидозе, некаторозе и др.
- Вызывает паралич мускулатуры гельминтов
- Низкая токсичность, применяется при энтеробиозе у детей
- Возможные побочные эффекты: тошнота, рвота, диарея, головная боль, головокружение, сонливость, сыпь

Формы выпуска: таблетки по 0,125; 0,25;
суспензия для приема внутрь 0,125 г/ 2,5 мл по
15 мл (флаконы)



НАФТАМОН

- Эффективен при аскаридозе, анкилостомидозе, энтеробиозе, трихостронгилоидозе, трихоцефалезе и др.
- Вызывает паралич мускулатуры гельминтов
- Возможные побочные эффекты: тошнота, рвота, диарея

Формы выпуска:

таблетки нафтамона «К», растворимые в кишечнике (enterosolubile) по 0,5;

таблетки нафтамона «К», покрытые оболочкой по 0,5



ПИПЕРАЗИНА АДИПИНАТ

- Эффективен при аскаридозе, энтеробиозе и др.
- Вызывает паралич мускулатуры гельминтов
- Малотоксичен
- Возможные побочные эффекты: тошнота, боли в животе, головная боль, бронхоспазм, аллергические реакции

Формы выпуска:

таблетки по 0,2; 0,5;

раствор для приема внутрь для детей 5% по 100 мл (флаконы)



ФЕНАСАЛ

- Эффективен при тениаринхозе, дифиллоботриозе, гименолепидозе и др.
- Парализует нервно-мышечную систему плоских червей и разрушает их покровные ткани
- Требуется назначение специальной диеты
- Возможные побочные эффекты: тошнота, аллергические реакции, обострение нейродермита

Форма выпуска: таблетки по 0,25



ДИТРАЗИНА ЦИТРАТ

- Эффективен при филяриозах
- Парализует нервно-мышечную систему гельминтов
- Побочные эффекты: кожный зуд, сыпь, кашель, эозинофильные инфильтраты, лимфаденопатия, увеличение размеров печени и селезенки

Форма выпуска: таблетки по 0,05; 0,1



ХЛОКСИЛ

- Эффективен при гельминтозах печени: описторхозе, фасциолезе, клонорхозе
- Побочные эффекты: увеличение размеров печени, боль в области печени, протеинурия, нарушения сердечного ритма, боли в области сердца, эозинофилия, аллергические реакции

Форма выпуска:

порошок для приема внутрь по 0,5; 1,0



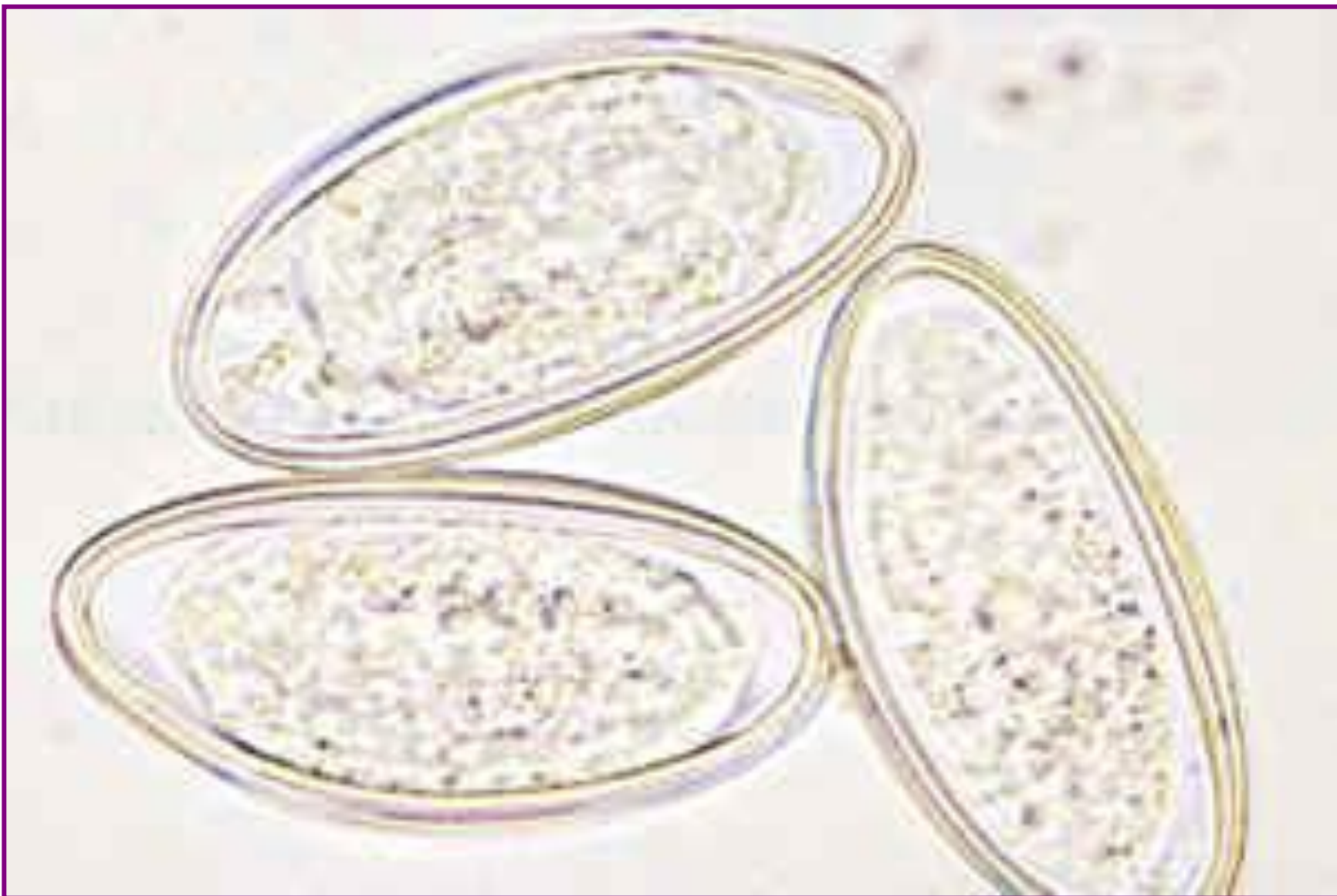
АСКАРИДОЗ



***Ascaris lumbricoides*,
яйцо, содержащее личинку**



ЭНТЕРОБИОЗ



Яйца *Enterobius vermicularis*, свежий мазок фекалий

ЭНТЕРОБИОЗ

Enterobius vermicularis

2-3 неделя развития в организме человека



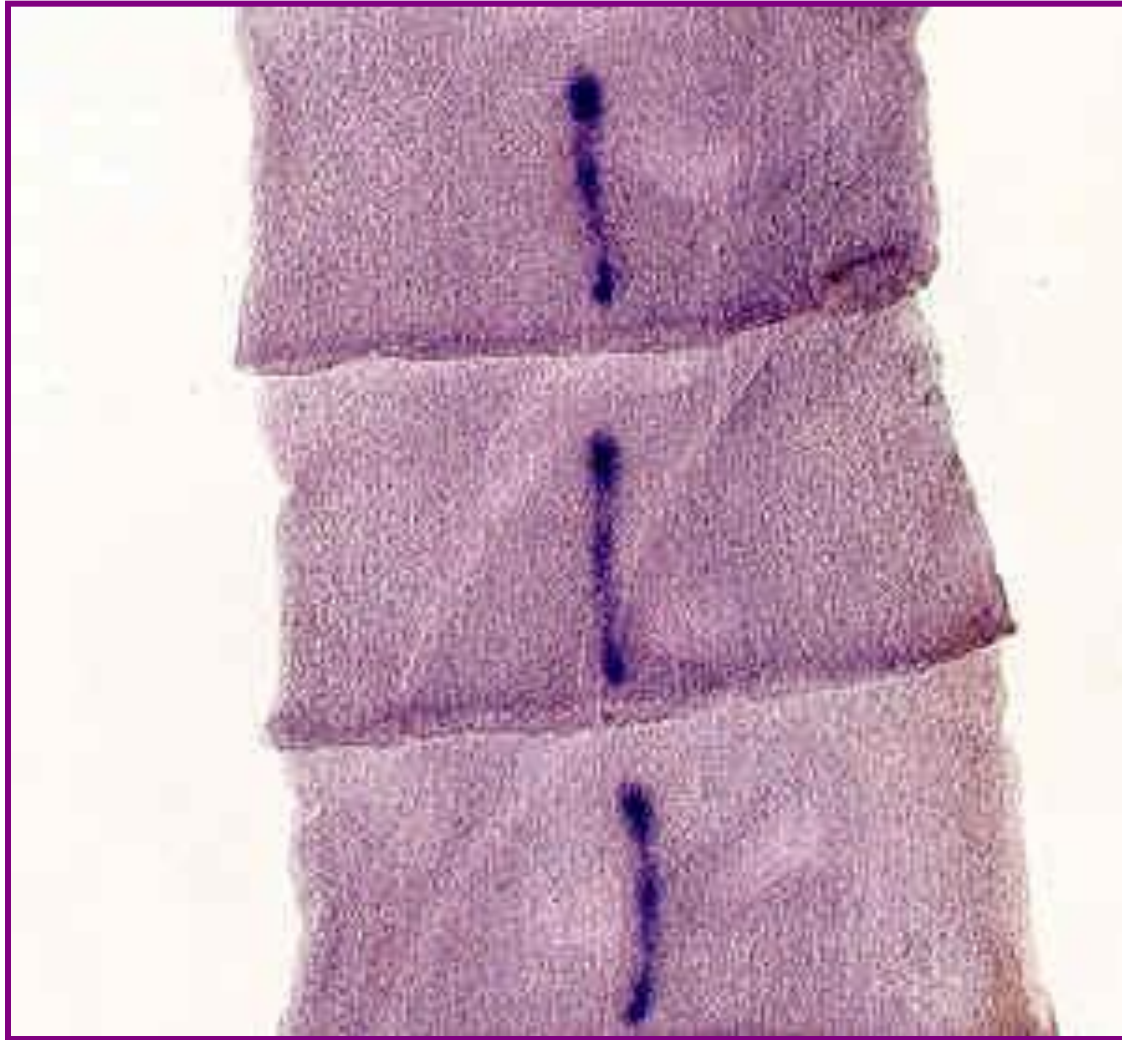
СТРОНГИЛОИДОЗ



Strongyloides stercoralis, мазок мокроты больного диссеминированным стронгилоидозом



ДИФИЛЛОБОТРИОЗ



**Три смежных членика *Diphyllbothrium latum*,
окраска гематоксилином**



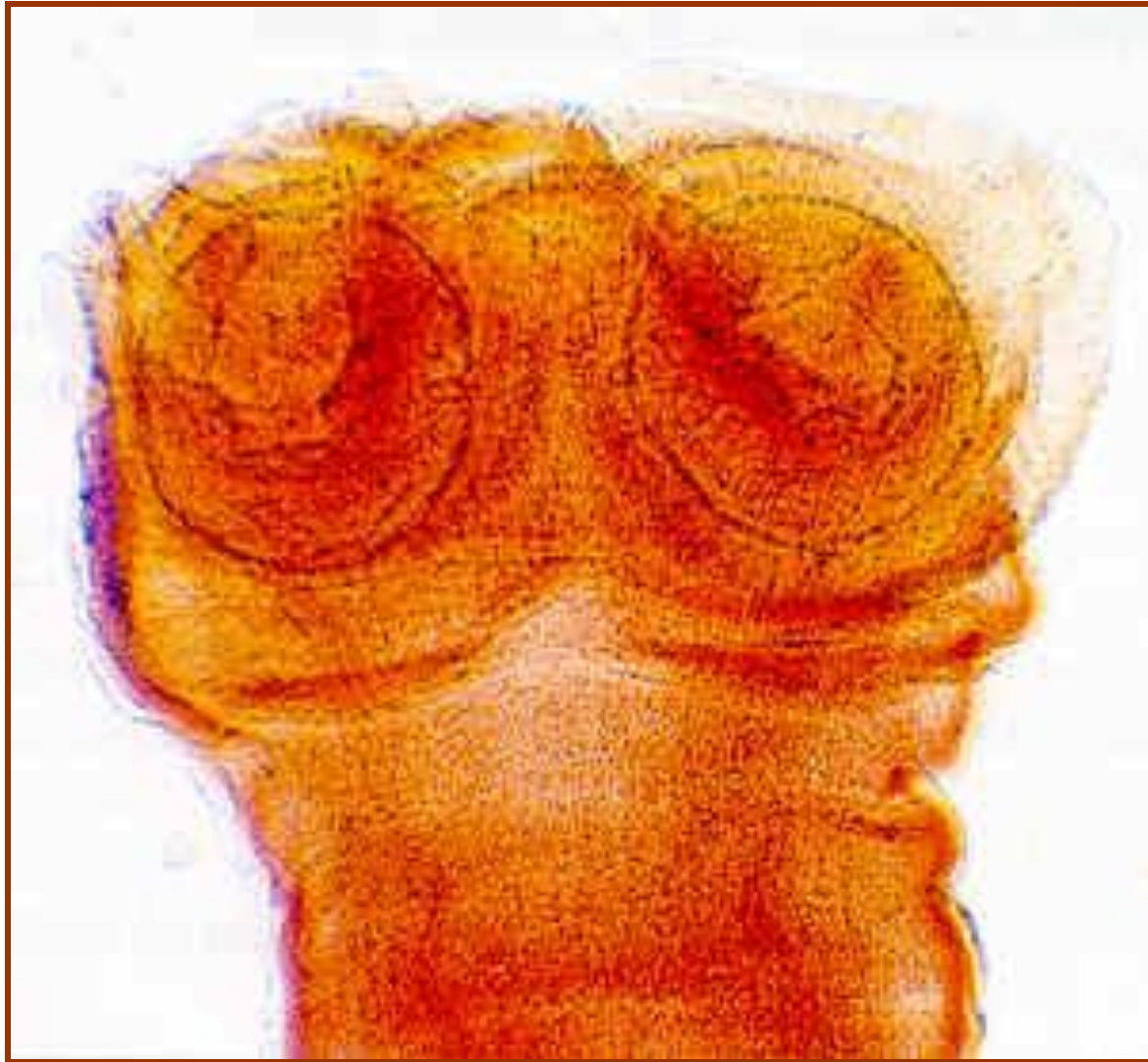
ДИФИЛЛОБОТРИОЗ



Яйца *Diphylobothrium latum*



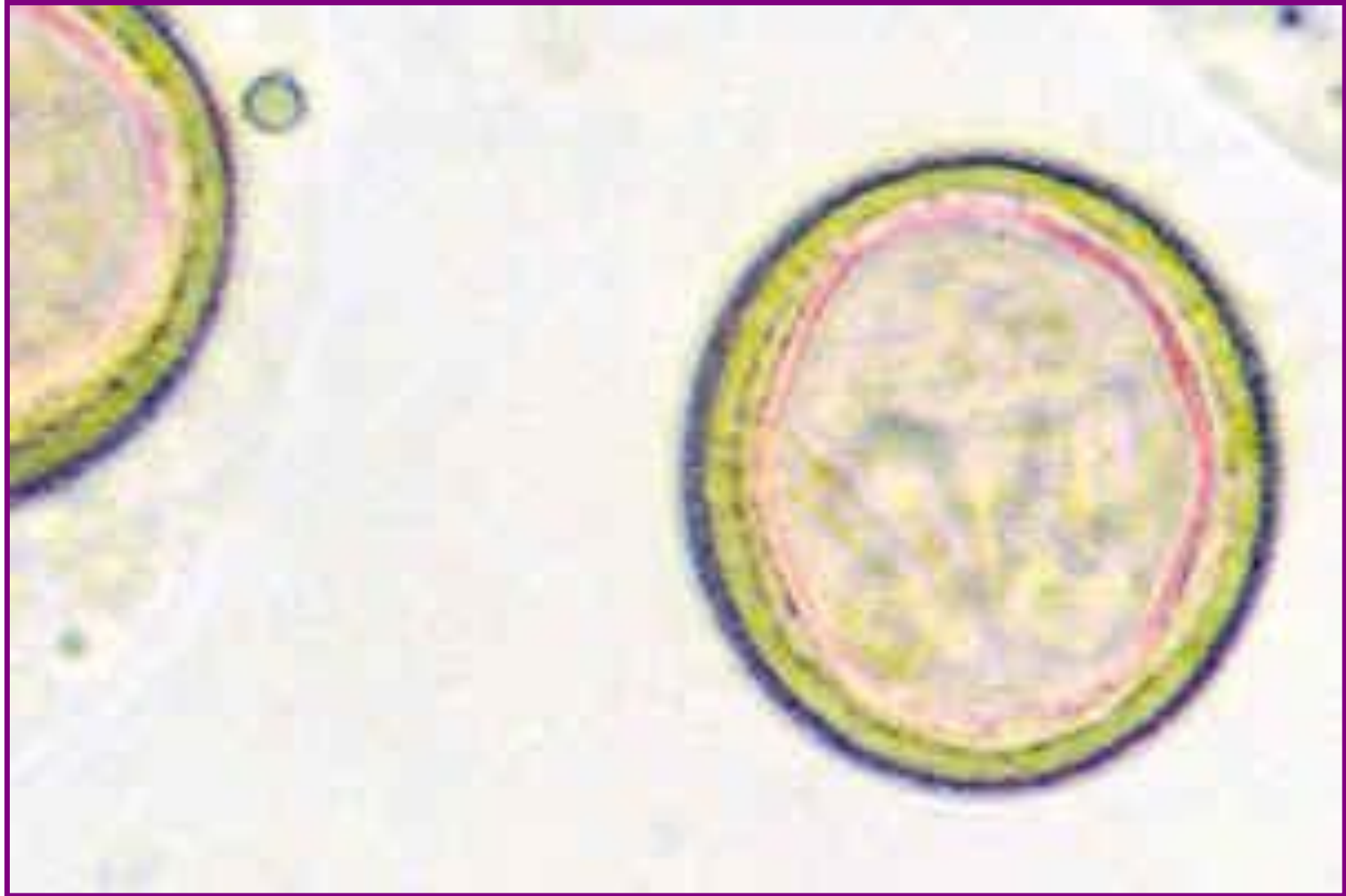
ТЕНИАРИНХОЗ



Головка бычьего цепня



ТЕНИАРИНХОЗ



Яйцо бычьего цепня



ТЕНИОЗ



ТЕНИОЗ

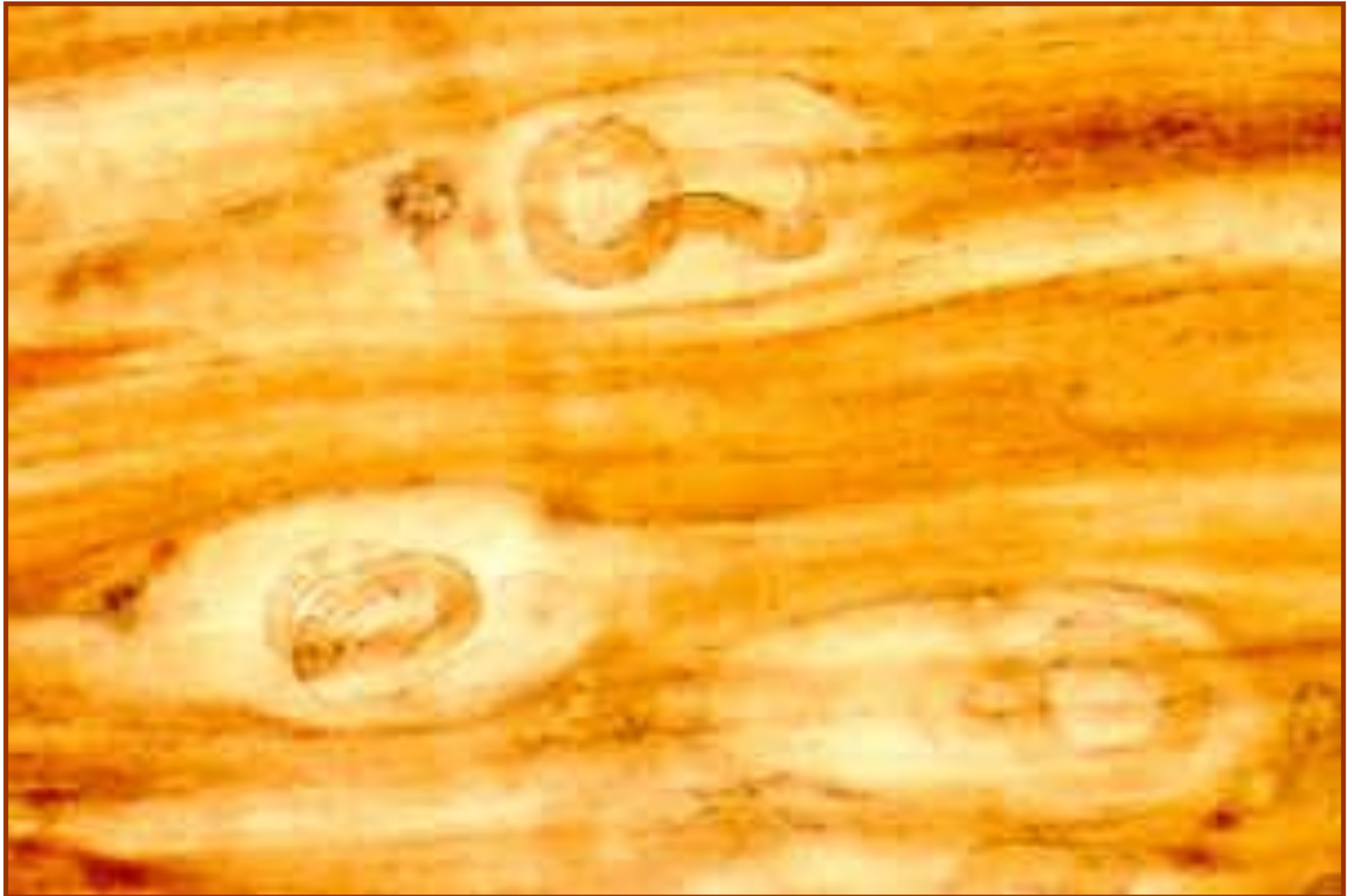


ОПИСТОРХОЗ

**Взрослая форма
*Opistorchis felineus***

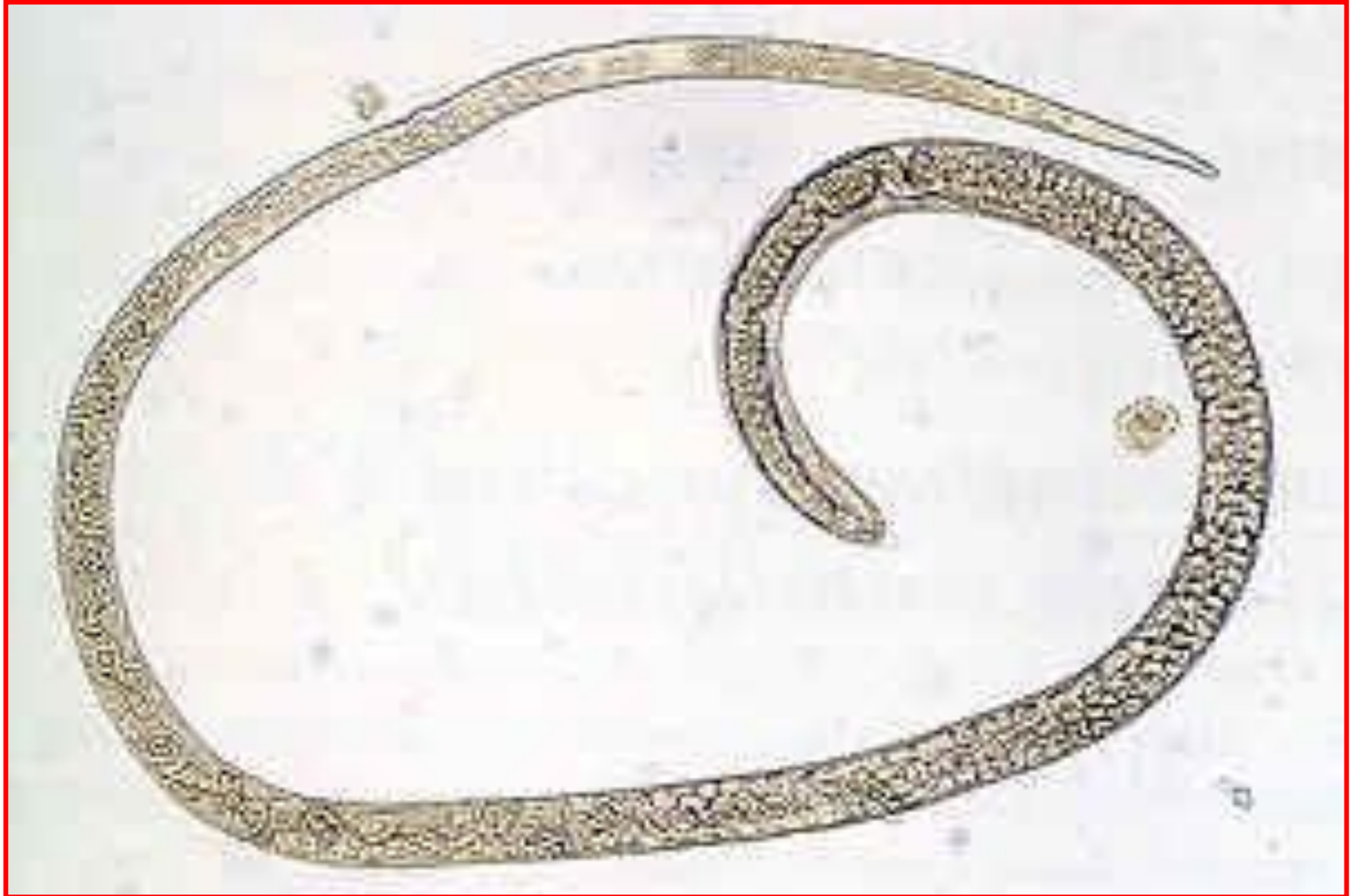


ТРИХИНЕЛЛЕЗ



Trichinella spiralis в скелетной мускулатуре ●

ТРИХИНЕЛЛЕЗ



ФАСЦИОЛЕЗЫ



ФИЛЯРИОЗЫ



Переносчики:

комары, мошки, слепни, мокрецы

Основной источник инфекции: обезьяны

Резервуар: люди



ПРЕПАРАТ ПЕРИФЕРИЧЕСКОЙ КРОВИ С ЛИЧИНКАМИ ФИЛЯРИЙ



ШИСТОСОМОЗЫ



Церкарий



ПУТИ ПЕРЕДАЧИ ШИСТОСОМОЗА



ДРАКУНКУЛЕЗ (РИШТА)

