

Антипротозойные средства



Классификация

Противомалярийные – хингамин, примахин, хлоридин, хинин

Для лечения амебиаза – метронидазол, эметин, тетрациклины.

Для лечения лямблиоза – метронидазол, фуразолидон, акрихин

Для лечения трихомоноза – метронидазол, тинидазол, трихомонацид

Для лечение токсоплазмоза – хлоридин, сульфаниламиды

Для лечения балантидиоза – тетрациклины, мономицин

Для лечения лейшманиоза – солюсурьмин, метронидазол

ПРОТИВОМАЛЯРИЙНЫЕ

лекарственные средства растительного и синтетического происхождения, которые используют в лечении и профилактике малярии.

Малярия – инфекционное заболевание экваториальной зоны.

Заболеваемость \approx 150 млн. ежегодно

Смертность \approx 1-2 млн. в год.

Возбудитель малярии относится к простейшим – малярийный плазмодий 4 видов:

- pl. vivax и pl. ovale – вызывают 3-х дневную малярию
- pl. malaria – 4-х дневную малярию
- pl. falciparum – тропическую малярию.



ПРОТИВОМАЛЯРИЙНЫЕ

Переносчик – самка комара рода *Anopheles*.

Развитие возбудителя малярии проходит

а) **в организме человека** – 2 неполовых цикла развития:

- в печени → тканевая (экзоэритроцитарная) шизогония

- в эритроцитах → эритроцитарная шизогония

б) **в организме комара** (после укуса больного) → половой цикл развития → в результате образуются спорозоиты (поэтому цикл называется спорогония)



В зависимости от того, на какую стадию развития плазмодия действует препарат, их делят по типу действия:

1. Гемошизонтоцидные препараты
2. Гистошизонтоцидные препараты
3. Гамонтотропные препараты
4. Споронтоцидные препараты

Цикл развития малярийного плазмодия



Спорогония в организме комара

Женская гамета (1), саморазрушение мужского гаметоцита и образование микрогамет (2), слияние микро- и макрогаметы (3) с образованием зиготы (4), проникновение оокинеты через стенку желудка (5), юная ооциста (6), сегментация ооцисты (7), разрыв ооцисты (8), попадание спорозоитов (9) в слюнные железы комара

Шизогония в организме человека

Первичная внеэритроцитарная или тканевая шизогония (доклинический период): проникновение спорозоитов в гепатоциты (10), превращение спорозоитов в трофозонты (11) с внутригепатоцитарным бесполом делением, образованием мерозоитов (12), разрушением клетки и их выходом в кровь.

При инфицировании *P. vivax* и *P. ovale* возможен переход части спорозоитов в состояние "спячки" - гипнозоиты (13) - криптобиотическая фаза, длящаяся месяцы, годы. Их активация - причина рецидива заболевания.

Эритроцитарная шизогония

Бесполой цикл: форма "кольца" (14), трофозонт (15), шизонт (16) и мерозонты (17)

Половой цикл: юные незрелые гаметоциты (18), мужские и женские гаметоциты (19).

I. Гемошизонтоцидные препараты

действуют на эритроцитарную стадию развития плазмодия:

- хингамин (хлорохин)
- гидроксихлорохин (плаквенил)
- хлоридин
- акрихин
- хинин
- примахин
- сульфаниламиды(сульфален, сульфапиридазин, сульфадиметоксин)
- сульфоны (диафенилсульфон)

II. Гистошизонтоцидные препараты

действуют на тканевую стадию развития плазмодия:

а) препараты, которые действуют на преэритроцитарные формы плазмодия:

- хлоридин
- примахин

б) препараты, которые действуют на параэритроцитарные формы

- примахин

III. Гамонтотропные препараты

а) гамонтоциды

- примахин

- хингамин

б) гамонтостатики

- хлоридин

IV. Споронтоцидные препараты

- хлоридин
- примахин

Комбинированные препараты

- фансидар
- метакельфин

По механизму шизонтотропные препараты делят

I. Препараты, нарушающие редупликацию ДНК и синтез РНК

- хингамин,
- гидроксихлоридин,
- акрихин,
- соли хинина.

Они обладают быстрым и сильным шизонтоцидным действием + не имеют специфичности (действуют на плазмодий + других простейших + клетки человека)

II. Препараты, блокирующие ферментные системы, которые принимают участие в синтезе белка

хлоридин

сульфаниламиды

Обладают медленным шизонтоцидным действием + высокой специфичностью!

Сульфаниламиды - ↓ ПАБК в фолиевую кислоту

Хлоридин - ↓ дигидрофолатредуктазу →
нарушают образование фолиевой кислоты → ↓
синтез белка

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ ПРОТИВОМАЛЯРИЙНЫХ ПРЕПАРАТОВ

1. Для лечения малярии (гемошизонтоциды)

- хингамин
- гидроксихлоридин
- хлоридин

2. Для профилактики рецидивов 3-х и 4-х дневной малярии (гистошизонтоциды)

- примахин

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ ПРОТИВОМАЛЯРИЙНЫХ ПРЕПАРАТОВ

3. Для индивидуальной профилактики малярии

- гистошизонтоциды (хингамин, хлоридин)
- гамонтоциды (хингамин)
- споронтоциды (хлоридин, примахин)
- гемошизонтоциды (хлоридин, хингамин)

4. Для общественной химиопрофилактики

- гамонтоциды (хлоридин, примахин)

Chingaminum (Chloroquinum, Resoquinum, Delagil)

Фармакологические свойства

- гемошизонтоцидное действие на все формы малярии, что связано с угнетением синтеза РНК и ДНК.
- амебоцидное действие
- антилямблиозное действие
- антитокоплазмозное действие
- другие - противовоспалительное, антигистаминное, местноанестезирующее (противоаритмическое), кардиодепрессивное, иммунодепрессивное (угнетают синтез ДНК и РНК)

Показания

- лечение всех видов малярии в остром периоде
- индивидуальная химиопрофилактика
- коллагенозы (РА, СКВ)
- аритмии (мерцательная, экстрасистолии)
- амебиаз
- лямблиоз, балантидиаз
- глистные инвазии (*Нymenolepis nana*)

Chingaminum (Chloroquinum, Resoquinum, Delagil)

Дозы: - per os после еды, курс 2-2,5 г по схеме

- в/м - при злокачественных формах малярии - 5% 10 мл
- в/в - при особенно тяжелых формах малярии - 5% 10мл на 40% глюкозе
- для профилактики малярии - 0,25 г 2 р/неделю на протяжении сезона передачи малярии

Побочные эффекты - головная боль, тошнота, ухудшение аппетита, боли в животе, брадикардия, лейкопения, ↓ печени, помутнение роговицы, оранжевый цвет сетчатки

Побочные эффекты проходят самостоятельно!!!

Противопоказания - беременность, ↓ печени и почек, тяжелые формы сердечно-сосудистой недостаточности.

Форма выпуска

- таб. 0,25; амп. 5% 5 мл.

Необходимо помнить: при длительном применении препарата необходим систематический осмотр окулиста и общий анализ крови.

Гидрохлорохин (Plaquenil)

Преимущество - лучше переносится

Действие - на неполовые эритроцитарные формы плазмодиев

Показания - острые приступы малярии

Для профилактики не подходит.

Дозы - 1-й день - 4 таб. + через 6 часов еще 2 таб.

2-й и 3-й день - по 2 таб. на прием

Противопоказания - осторожно при тяжелых поражениях печени; беременность; ретинопатии.

Форма выпуска

- таб. 0,2.

Chloridinum (Daraprim*)

Свойства - гемошизонтоцидное действие на все формы малярии, токсоплазмоз, лейшманиоз

Недостатки - быстро вызывает устойчивость плазмодия

Показания

- лечение всех форм малярии
- общественная и индивидуальная химиопрофилактика

Побочные эффекты

- диспепсия, головная боль, ↓ печени, анемия, лейкопения → В₁₂ + фолиевая кислота

Противопоказания

- беременность, поражение кроветворных органов, почек.

Форма выпуска

- таб. 0,005 - 0,01 - 0,025

Осторожно при почечной и печеночной недостаточности
→ 1 раз в неделю анализ крови.

Primachinum (Primaquin)

Действует на презэритроцитарные и половые формы всех видов плазмодия.

Показания

- профилактика отдаленных рецидивов 3-х и 4-х дневной и тропической малярии
- индивидуальная химиопрофилактика вместе с хингамином
- общественная химиопрофилактика

Побочные эффекты

- в больших дозах угнетение кроветворения (агранулоцитоз, лейкопения)
- внутрисосудистый гемолиз с гемоглобинурией!!! (дефицит Г-6-ФДГ)

Форма выпуска

- таб. 0,003 - 0,009 г

Bigumalum

Недостаток - медленно наступает эффект + быстро развивается устойчивость плазмодия

Обладает шизонто- и гамонтоцидным действием.

Хорошо переносится.

Показания - лечение и профилактика малярии

Курс лечения - 4-5 дней, при тяжелых формах до 7 дней.

Побочные эффекты

- угнетает секрецию соляной кислоты; анорексия.

Форма выпуска

- таб. и фл. 0,1 - 0,3 г;

- для детей 0,05.

Chininum

Алкалоид из коры хинного дерева.

100 лет был единственным специфическим противомалерийным средством.

Обладает гемошизонтоцидным действием на все формы малярии.

Используется только при неэффективности синтетических лекарственных средств.

Свойства

- анальгетическое
- жаропонижающее
- угнетает ЦНС
- тормозит возбудимость миокарда

Достаточно токсичный препарат!

Дозы - суточная доза = 1,2-1,5 г (в 3 приема) на протяжении 5-7 дн.

Побочные эффекты - головокружение, нарушение слуха и зрения аж до слепоты, диспептические явления, аллергические реакции.

Противопоказания - беременность, дефицит Г-6-ФДГ, поражение слуха.

Комбинированные препараты

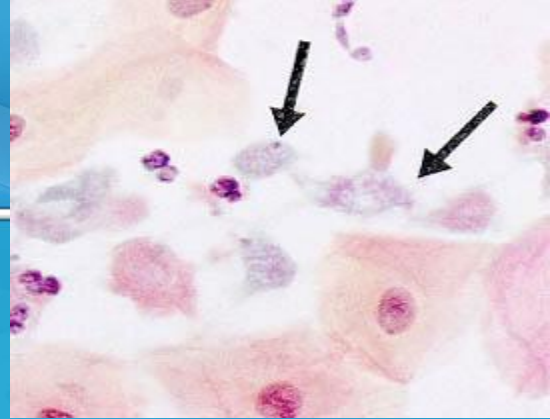
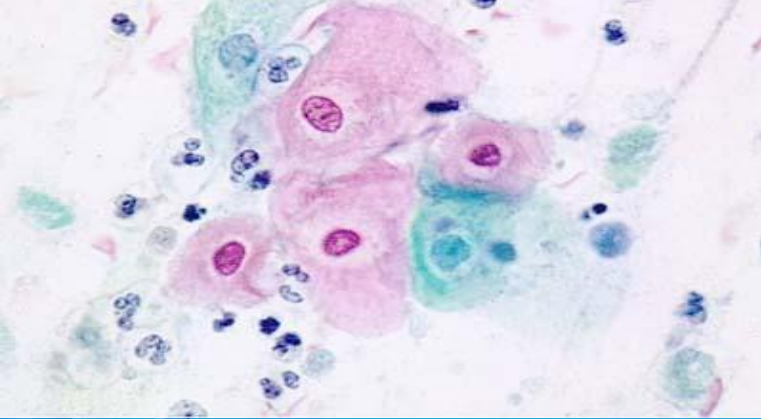
Fansidar - хлоридин + сульфадоксин

Metakelfin - хлоридин + сульфален

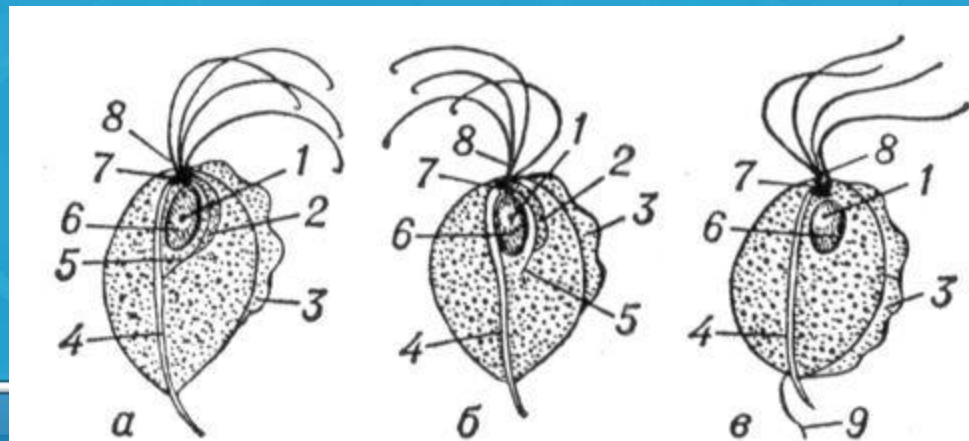
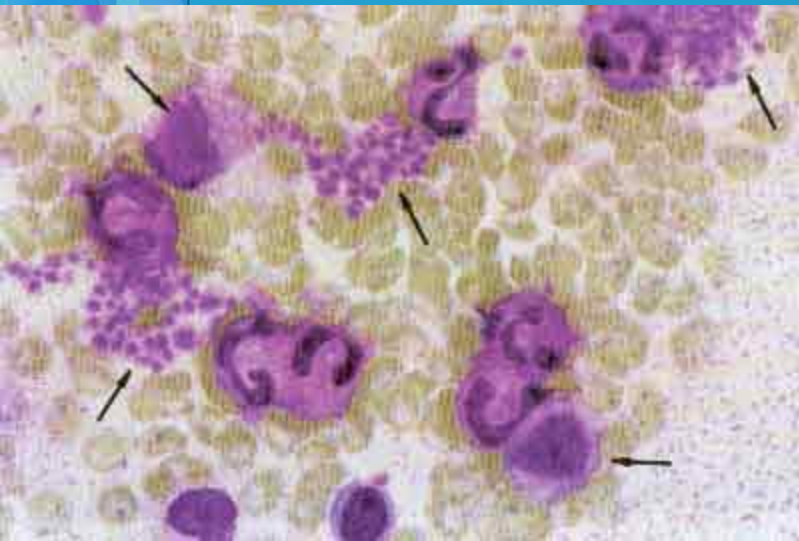
Их преимущество - медленнее
вырабатывается устойчивость
плазмодия.

ПРИНЦИПЫ ПРИМЕНЕНИЯ ПРОТИВОМАЛЯРИЙНЫХ СРЕДСТВ

- Курсовое (цикловое) лечение, соответственно стадии развития плазмодия.
- Комбинированная терапия.
- Per os + в/в (при тяжелых состояниях)
- Противорецидивное лечение в течение 2-х лет.
- Общественная химиопрофилактика в очаге малярии.
- Контроль функционального состояния внутренних органов.



СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ТРИХОМОНОЗА



Metronidazolium - Trichopol* - MetrogyI*

Свойства - действует на трихомонады, лямблии, амебу, анаэробы, Нр.

Механизм действия - нарушается синтез ДНК → вызывает гибель простейших.

Дозы - по 0,25 2 р/д 10 дней. Женщинам и беременным свечи по 0,5 препарата вагинально.

Противопоказания - беременность, лактация, вместе с алкоголем и снотворными.

Побочные эффекты - диспепсии, головная боль.

Форма выпуска

0,25- 0,5; супп. 0,5.

MetrogyI - раствор для в/в 0,5% 100 мл.

Используется в лечении амебной дизентерии,

- хронического алкоголизма
- язвенной болезни
- профилактики анаэробной инфекции в хирургии



Tinidazolum - Fasiorn*

Показания

 трихомоноз

 лямблиоз

 амебиаз



Преимущество

□ однократный прием всей лечебной дозы.

Противопоказания – такие же как и у метронидазола

Дозы

2,0 одноразово

0,5 x 4 р/д (через 15 мин)

Форма выпуска



таб. 0,15 - 0,3 - 0,5



Trichomonacidum

Дозы

- per os по 0,3 в сутки (2-3 приема) на протяжении 3-5 дн.

Курс лечения повторить через 10-12 дней.

Женщинам + местно вагинальные суппозитории по 0,05 г 10 дней.

Побочные эффекты - местнораздражающее действие → неприятные ощущения во влагалище (уменьшают дозу)

Форма выпуска

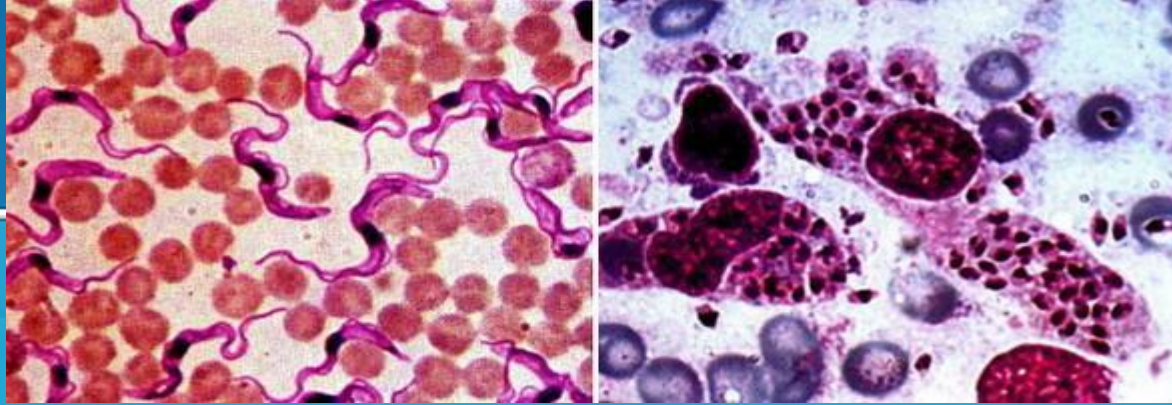


таб. и супп. 0,05



СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ЛЕЙШМАНИОЗА

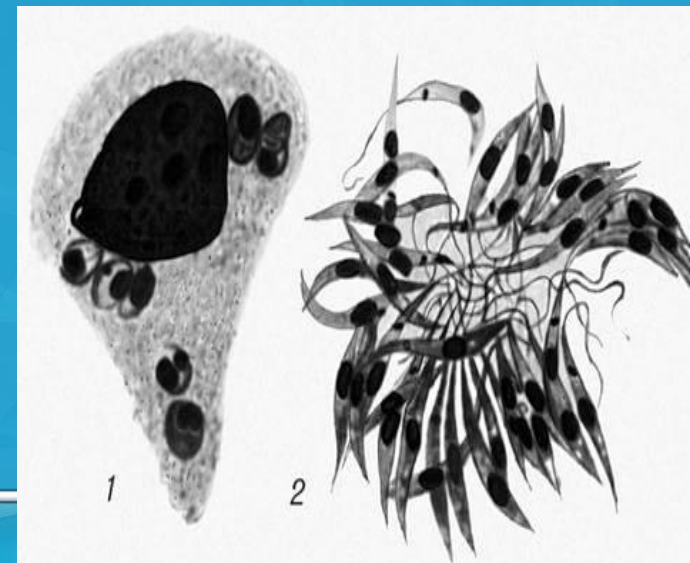




Возбудитель - простейшие из рода
Leishmania

Классификация лейшманиоза

- висцеральный
- кожный
- слизисто-кожный



При висцеральном назначают

1. Препараты сурьмы

- неостибазан,
- солюсурмин,
- меглюмина антимомиат и др.

2. Ароматические диамидины

- стильбамидин,
- пентамидин

Лечение кожного и кожно-слизистого лейшманиоза

- акрихин,
- аминохинолин,
- препараты сурьмы



Solusurminum

Лечение висцерального + хронических форм кожного лейшманиоза

Кумулирует!

Дозы - в/в ежедневно 20% р-р по схеме.

Побочные эффекты - кашель, тошнота, рвота, брадикардия, поражение суставов, коллапс, аллергии.

Противопоказания - инфекции, тяжелые дистрофические поражения внутренних органов (печени).

Форма выпуска

- амп. 20% 10 мл.

Аминохинолум

Для лечения кожного лейшманиоза, лямблиоза, токсоплазмоза, неспецифического язвенного колита.

Дозы - per os 2 цикла по 10-15 дней с перерывом в 7 дней

Побочные эффекты - головная боль, диспепсии, аллергия

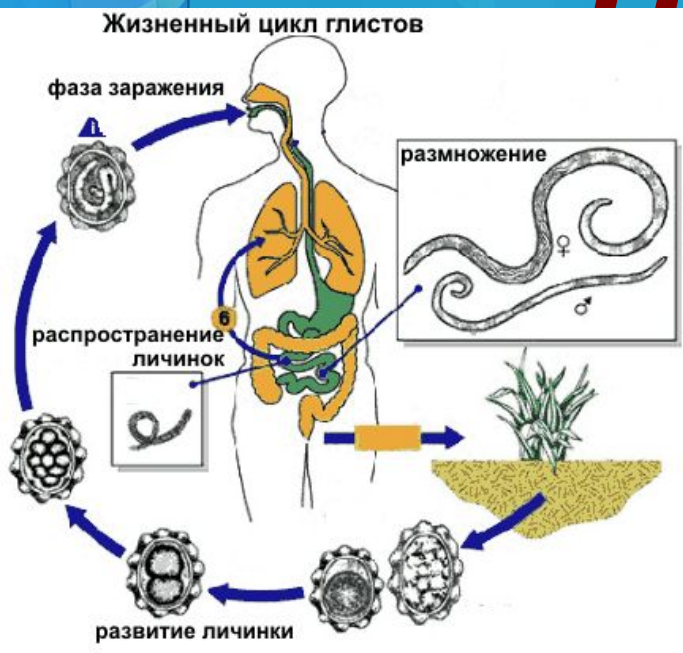
Форма выпуска

5. 0,025 - 0,05





ПРОТИВОГЛИСТНЫЕ ПРЕПАРАТЫ



Известно 150 видов гельминтов, в СНГ - 70 видов.

Расширение контактов с миром - тропические гельминтозы, которые сегодня рассматриваются ВОЗ как самый важный фактор, который ухудшает здоровье, физическую и умственную деятельность людей в развивающихся странах.

Дегельментизация - комплекс мероприятий, направленных на лечение больных глистными инвазиями с одновременной профилактикой внешней среды от рассеивания гельминтов.

Виды глистов:

Круглые - Nematoda

Плоские - Cestoda

Сосальщики - Trematoda

Есть 2 группы антигельминтных средств для ликвидации кишечных гельминтов для ликвидации внекишечных гельминт

Средства для борьбы с нематодозами

Levamisolum - Decaris*

Наиболее эффективен при аскаридозе.

Механизм действия - блокирует СДГ в митохондриях аскарид → нарушается энергообразование → паралич мускулатуры.

Дозы - одноразово взрослым 0,15; детям - 0,05 перед сном. Повтор через 1 неделю.

Преимущества - нет необходимости в диете и слабительном.

Побочные эффекты - головная боль, диспепсия, аллергия, агранулоцитоз

Противопоказания - беременность, ↓ печени и почек

Форма выпуска

- табл. 005 - 0,15.



Mebendazolium -Вермох

Препарат широкого спектра действия → круглые, плоские, сосальщики + эхинококк.

Механизм действия - вызывает энергодефицит в тканях гельминта за счет ↓ запасов гликогена и усвоения глюкозы.

Важно - не требует диеты и слабительных средств.

Побочные эффекты - диспепсии, аллергии

Дозы - взрослым и подросткам однократно по 1 таб. (0,1);

дети до 10 лет - 0,025 - 0,05.

Противопоказания - беременность.

Форма выпуска

 таб. 0,1



Piperazini adipinas

Показания - энтеробиоз + аскаридоз

Механизм действия – парализует нервно-мышечный аппарат червей

Важно – не требуется диета и слабительные средства!
Малотоксичный!

Дозы – взрослым и после 7 лет суточная доза 3-4 г однократно или 2 г x 2 р/д; до 1 года – 0,2; 2-3 года – 0,3; 4-5 лет – 0,5; 6-8 лет – 0,75.

Побочные эффекты – диспепсии, боль в животе, сонливость, вялость.

Противопоказания

хронические заболевания печени и почек
поражение ЦНС.

Форма выпуска

 таб. 0,2 – 0,5;

 фл. 5% 100 мл (1 ч.л. = 0,25)

Pyrantelium - Combantrin*

На все виды нематод, кроме стронгилоидоза

Механизм действия – парализует нервно-мышечный аппарат червей

Важно – не нужно слабительных. Хорошо переносится.

Побочные эффекты – иногда диспепсии, головная боль, головокружение, сонливость.

Дозы – аскаридоз + энтеробиоз → одноразово 10 мг/кг

Противопоказания

☠ беременность

Форма выпуска

- ☐ таб. 0,25;
- ☐ фл. суспензия по 15 мл



Naphthamonum

Лучше всего при аскаридозе, трихоцефалезе, анкилостоматозе.

Механизм действия – парализует нервно-мышечный аппарат червей.

Обладает слабительным действием → не нужны слабительные.

Дозы – взрослым и детям старше 10 лет по 5,0 однократно натощак, не разжевывая за 2 часа до завтрака; до 5 лет – 2-2,5 г; 6-10 лет – 3-4 г.

Побочные эффекты – диспепсии, которые быстро проходят.

Противопоказания

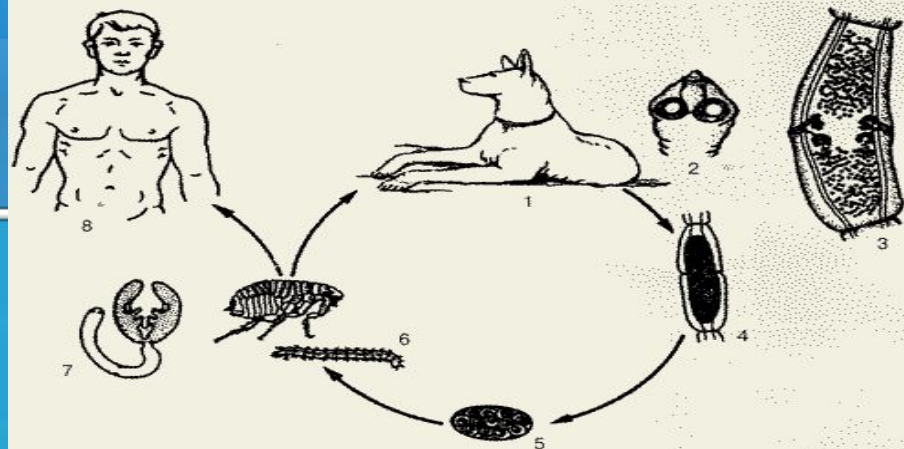
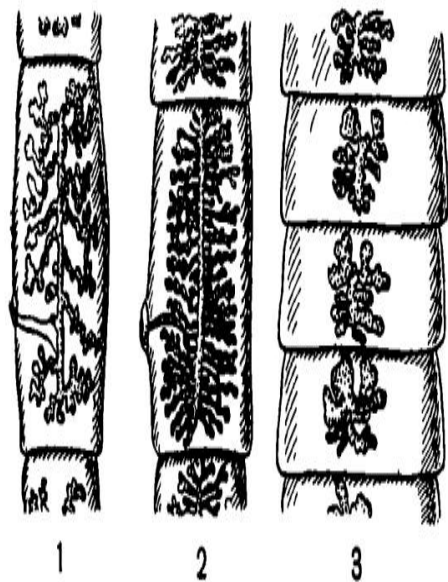
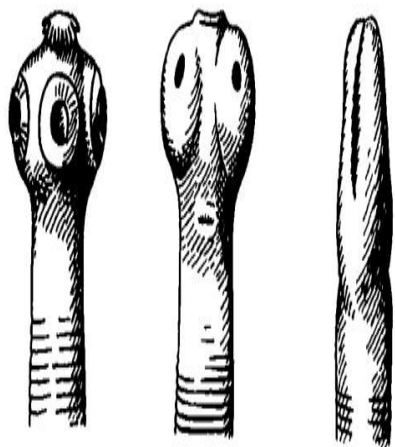


Снижение функции печени

Форма выпуска



таб. 0,5



СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ЦЕСТОДОЗОВ



Рис. 216. Цестоды, паразитирующие во взрослой стадии в кишечнике человека:

1 — цепень свиной (*Taenia solium*); 2 — цепень бычий (*Taeniarhynchus saginatus*); 3 — лентец широкий (*Diphyllobothrium latum*). В верхний ряд — головки цестод, нижний — зрелые членики.

Phenazalum

На всех ленточных глист: бычий цепень (тениаринхоз); широкий лентец (дифиллоботриоз); свиной цепень (тениоз).

Дегельминтизация по схеме.

Форма выпуска

 таб. 0,25

Aminoacrichinum

при карликовом цепне (гименолепидоз)

Лечение по схеме после специальной подготовки (диета + слабительные)

Побочные эффекты – диспепсия, $\uparrow t^{\circ}$ тела

Противопоказания – язвенная болезнь, гастрит.

Форма выпуска

 таб. 0,1

Seмен Cucurbitae - Семена тыквы

Действует на все 4 вида ленточных глистов.

Действующее вещество – кукурбитин (в зеленой кожуре семян).

Механизм действия – угнетает жизнедеятельность глистов.

Требует специальной подготовки за 2 дня до лечения – клизма + слабительные.

Доза – 300 г очищенных семян растереть в ступке

100 г меда или варенья.

на протяжении 1 часа.

Через 3

слабительное + клизма.

Можно

10 г семян;

детям – 100 - 300 г.



ВНЕКИШЕЧНЫЙ ГЕЛЬМИНТОЗ

Chloxylum

Вызывает гибель гельминтов в печени, желчных путях, поджелудочной железе.

Показания - описторхоз и фасцеолез печени, клонорхоз

Правила лечения – обезжиренная диета + спазмолитики.

Схемы лечения.

Побочные эффекты – сонливость, боль в сердце и печени, аллергии, аритмии

Противопоказания

снижение работы печени, беременность, миокардит

Форма выпуска

порошок.



Ditrazini citras

Показания - филяриатоз в тропических странах.

Механизм действия – нарушает двигательную активность глист; нарушает способность к размножению

Доза – per os 2 мг/кг 3 р/д 10 дней; 3-5 курсов по 10 дней с перерывом 10 дней.

Побочные эффекты – диспепсии, головная боль, $\uparrow t^{\circ}$ тела при распаде филярий, аллергические реакции.

Форма выпуска



таб. 0,05 - 0,1



***Спасибо за
внимание!!!***