

Тема лекции:

**Противомикробные средства
избирательного действия
(ПМС)**

**Доцент кафедры общей и клинической
фармакологии с курсом ФПК и ПК
*Владимир Михайлович Концевой***

Это лекарственные препараты, которые подавляют развитие патогенных микробов во внутренней среде организма.

Их применяют для профилактики и лечения инфекционных заболеваний.

К противомикробным средствам относят:

1. Природные ПМС
(антибиотики)
2. Синтетические ПМС

Классификация ПМС по химическому строению

1. Сульфаниламиды
Сульфадиазин и др.
2. Сульфоны
Дапсон
3. Параминосалицилаты
ПАСК
4. Диаминопиримидины
Триметоприм

5. Хинолоны

Кислота налидиксовая

6. Фторхинолоны

Норфлоксацин

Ципрофлоксацин и др.

7. β -лактамы

Пенициллин

Цефалоспорины

Монобактамы

Карбапенемы

8. Тетрациклины

Доксициклин и др.

9. Нитробензены
Хлорамфеникол

10. Аминогликозиды
Стрептомицин
Гентамицин
Неомицин

11. Макролиды
Эритромицин
Рокситромицин
Азитромицин

12. Полипептиды
Полимиксины

13. Нитрофураны

Нитрофурантоин

Фуразолидон

14. Нитроимидазолы

Метронидазол

Тинидазол

15. Производные изоникотиновой кислоты

Изониазид

16. Полиены

Нистатин

Амфотерицин - В

17. Линкозамиды
Линкомицин
Клиндамицин

18. Имидазолы
Миконазол
Кетоконазол

19. Разного строения
Рифампицин
Ванкомицин
Циклосерин
Этамбутол и др.

Классификация по механизму противомикробного действия

1. Ингибиторы синтеза клеточной стенки

Пенициллины. Цефалоспорины.
Карбапенемы. Монобактамы.
Циклосерин. Ванкомицин.

2. Повышающие проницаемость цитоплазматической мембраны

Полимиксин. Нистатин.
Амфотерицин – В.

3. Ингибиторы синтеза белка

Тетрациклины. Эритромицин.

Линкомицин. Клиндамицин.

Хлорамфеникол.

Стрептомицин. Гентамицин.

4. Ингибиторы ДНК-гиразы

Фторхинолоны

5. Ингибиторы функций ДНК

Рифампицин

Метронидазол

6. Ингибиторы синтеза ДНК

Идоксуридин

Ацикловир

Зидовудин

7. Разные ингибиторы микробного метаболизма

Сульфаниламиды

Триметоприм и др.

Классификация по спектру действия

1. Узкого спектра

Бензилпенициллин

Стрептомицин

Эритромицин

2. Широкого спектра

Тетрациклины

Хлорамфеникол

Классификация по типу действия

1. Бактериостатического действия

Сульфаниламиды

Тетрациклины

Хлорамфеникол

Эритромицин

Этамбутол

2. Бактерицидного действия

Пенициллины

Цефалоспорины

Аминогликозиды

Рифампицин

Котримоксазол

Фторхинолоны

Изониазид

Классификация по активности против микробов

1. Антибактериальные:

Пенициллины. Аминогликозиды и др.

2. Антигрибковые:

Гризеофульвин. Нистатин и др.

3. Антивирусные:

Ацикловир. Зидовудин и др.

4. Антипротозойные:

Метронидазол. Хингамин и др.

Основные принципы применения ПМС

1. Установление природы возбудителя заболевания и его чувствительности к ПМС.
2. Раннее начало лечения.
3. Создание подавляющей концентрации ПМС в очаге инфекции.

4. Оптимальная продолжительность лечения
5. Своевременная замена ПМС при его непереносимости больным или при отсутствии лечебного эффекта
6. Применение средств, повышающих устойчивость организма к микробам.

Антибиотики

Это природные ПМС, которые образуют и выделяют в окружающую среду различные грибки.

В настоящее время многие антибиотики получают синтетически путем изменения химической структуры природных антибиотиков.

Классификация антибиотиков по химическому строению

1. β -лактамы
2. Макролиды
3. Тетрациклины
4. Нитробензены
5. Аминогликозиды
6. Полипептиды
7. Гликопептиды
8. Линкозамиды
9. Разного строения

β-лактамные антибиотики

1. Пенициллины
2. Цефалоспорины
3. Карбапенемы
4. Монобактамы

Классификация пенициллинов

1-е поколение

Бензилпенициллин

Феноксиметилпенициллин

2-е поколение

Оксациллин

3-е поколение

Ампициллин

Амоксициллин

4-е поколение

Азлоциллин

Характеристика пенициллинов

Бензилпенициллин

Фармакокинетика

- Вводят в/м через 4-6 часов
- Не проникает через ГЭБ
- Быстро выделяется с мочой в неизмененном виде
- Разрушается β -лактамазами устойчивых микробов

Спектр противомикробного действия БП

- Действует на грам + бактерии, которые не образуют β -лактамазу: стрептококки, пневмококки
- Активен против менингококков, гонококков, палочек дифтерии, сибирской язвы, возбудителей гангрены, столбняка и сифилиса
- Устойчивы к БП возбудители кишечных инфекций, туберкулеза, риккетсии, простейшие, вирусы и грибки

Механизм действия БП

Ингибирует транспептидазу микробов, блокирует синтез пептидогликана клеточной стенки и ее образование .

Снижает резистентность бактерий, что приводит к их разрушению.

Действие бактерицидное.

Применение БП

Инфекционные заболевания,
вызванные чувствительной к БП
микрофлорой:

- Пневмония
- Плеврит
- Перитонит
- Эндокардит
- Инфекции кожи и мягких тканей и др.

Побочные эффекты БП

1. Аллергические реакции
2. Анафилактический шок
3. Тромбофлебит
4. Инфильтраты и др.

Формы выпуска БП

- *Benzylpenicillin sodium*

Флаконы 500000 и 1000000 ЕД

Вводят в/м, в/в ч/з 4-6 часов

- *Benzathine benzylpenicillin*

Флаконы 1200000 и 2400000 ЕД

Вводят в/м 1 раз в неделю

Оксациллин

Отличие от БП:

1. 2-е поколение
2. Устойчив к β -лактамазе
3. Устойчив в кислой среде
желудочного сока

Форма выпуска

Oxacillinum –natrium

Таблетки 0,25 и 0,5

Флаконы 0,25 и 0,5

Вводят внутрь, в/м, в/в через
6 часов

АМПИЦИЛЛИН

Отличие от БП:

1. 3-е поколение
2. Активен против грам + и грам –
микробов (кишечная палочка,
шигеллы, сальмонеллы,
клебсиеллы, протей)
3. Устойчив в кислой среде
желудочного сока

Форма выпуска

Ampicillin

Таблетки 0,25

Флаконы 0,25 и 0,5

Вводят внутрь, в/м, в/в
через 6 часов

АМОКСИЦИЛЛИН

Сходен с ампициллином, но лучше всасывается в ЖКТ.

Применяют при язвенной болезни.

При дизентерии не эффективен, т.к. всасывается в тонком кишечнике.

Формы выпуска

1. Amoxicillin

Таблетки 0,75 и 1,0

Внутрь через 8 часов

2. Taromentin

Таблетки 0,25 или 0,5 амоксициллина
и 0,125 клавуната (ингибитор β -лактамазы
микробов)

Вводят внутрь через 8 часов

Флаконы 0,5 и 1,0 амоксициллина и 0,1
и 0,2 клавуната

Вводят в/в через 8 часов

Азлоциллин

Отличие от БП:

1. 4-е поколение
2. Разрушается в кислой среде желудочного сока
3. Вводят в/м и в/в
4. Широкий спектр действия
5. Активен против синегнойной палочки
6. Разрушается β -лактамазами

Форма

выпуска

Azlocillin

Флаконы 0,5-1,0-2,0 и 5,0

Вводят в/в через 6 часов

Максимальная суточная доза
24,0

При почечной недостаточности
дозы снижают

Цефалоспорины

1-е поколение

Цефазолин. Цефалоридин и др.

2-е поколение

Цефуроксим. Цефокситин и др.

3-е поколение

Цефтазидим. Цефотаксим.
Цефтриаксон.

4-е поколение

Цефепим. Цефпиром.

Цефазолин

Сходен с БП

Активен против грам + бактерий

Отличие от БП:

1. Устойчив к β -лактамазе
2. Активен против некоторых грам-бактерий (эшерихии, клебсиеллы, гемофиллюс, протей)

Форма выпуска

Cefazolin

Флаконы 0,5 и 1,0

Вводят в/м, в/в через
12 часов

Цефалоридин

Сходен с БП, но устойчив к β -
лактамазе

Отличие от БП:

1. Активен против стафилококков, образующих β -лактамазу
2. Нефротоксичен

Форма

выпуска

Cefaloridinum

Флаконы 0,25-0,5-1,0

Вводят в/м, в/в через
часов

6

Цефуроксим

Отличие от БП:

1. 2-е поколение
2. Менее активен против грам + , но сильнее действует на грам – микробов
3. Проникает во все ткани
4. Проходит через ГЭБ, создает терапевтическую концентрацию в ликворе.
5. Устойчив к β -лактамазе

Форма выпуска

Cefuroxime

Флаконы 0,25-0,75-1,0

Вводят в/м, в/в через
часов

6

Цефтазидим

Отличие от БП:

1. 3-е поколение
2. Широкий спектр действия, но более активен против грам — бактерий и синегнойной палочки
3. Устойчив к β -лактамазе
4. Проникает через ГЭБ, используют при менингите

Форма выпуска *Ceftazidim*

Флаконы 0,5 и 1,0

Вводят в/м, в/в через
8-12 часов

Цефепим

Отличие от БП:

1. 4-е поколение
2. Проходит через ГЭБ
3. Спектр действия более широкий, чем у 3-его поколения. Активен против грам + и грам – бактерий и против синегнойной палочки
4. Устойчив к β -лактамазе

Форма

выпуска

Ceferite

Флаконы 1,0

Вводят в/м, в/в через
12 часов

Карбапенемы

Это синтетические антибиотики, которые в своей структуре содержат β -лактамное кольцо но не являются пенициллинами или цефалоспорины.

К ним относят имипенем и меропинем.

Имипенем

- В ЖКТ не всасывается
- Вводят в/в
- Устойчив к β -лактамазе
- Разрушается в почках дегидропептидазой, поэтому применяют совместно с ингибитором дегидропептидазы — циластатином
- Выделяется с мочой

- Блокирует синтез клеточной стенки бактерий
- Действует бактерицидно
- Спектр действия широкий: грам + и грам – микробы, акинетобактер, бактероиды, клостридии, эшерихии, гемофилюсы, клебсиеллы, морганеллы, пептококки, протей, синегнойная палочка, стрептококки и стафилококки.

Форма выпуска

Tienat

Комплексный препарат

Флакон содержит 0,5
имипенема и 0,5 циластатина

Вводят в/в через 6 часов при
тяжелых инфекциях разной
локализации.

Монобактамы

К этой группе относят
азтреонам — антибиотик,
у которого β -лактамное
кольцо не
конденсировано
с
гетероциклом.

Азтреонам

- Вводят в/м и в/в через 6 часов
- Устойчив к β -лактамазе
- Выделяется с мочой
- Блокирует синтез клеточной стенки бактерий
- Действует бактерицидно
- На грам + микробы не действует
- Активен против грам – бактерий: энтеробактер, эшерихии, гемофилюсы, клебсиеллы, протей, синегнойная палочка

Форма выпуска

Aztreonam

Флаконы 0,5-1,0-2,0

Вводят в/м, в/в через
6 часов

АМИНОГЛИКОЗИДЫ

Это антибиотики, в структуру которых входят аminosахара, соединенные гликозидной связью с агликоном.

К ним относят:

Стрептомицин

Гентамицин

Амикацин и др.

Стрептомицин

Фармакокинетика

- В ЖКТ не всасывается
- Вводят в/м
- Распределяется внеклеточно
- Проникает в полость брюшины и плевры, проходит через плацентарный барьер
- Не проникает через ГЭБ
- Выводится с мочой в неизменном виде

Спектр действия стрептомицина

Активен против туберкулезной палочки, возбудителей туляремии и чумы

Подавляет патогенные кокки бруцеллы, синегнойную палочку и другие грам + и грам – бактерии.

Устойчивы к стрептомицину анаэробы, спирохеты, риккетсии, вирусы, грибки, простейшие.

Механизм действия стрептомицина

Связывается с 30S –субъединицей бактериальной рибосомы, ингибирует связывание аминоацил-tРНК с акцепторным участком, нарушает считывание кода с m-РНК, что приводит к синтезу неактивных белков. Вторично нарушает барьерные функции цитоплазматической мембраны бактерий. Действует бактерицидно.

Применение стрептомицина

При инфекционных
заболеваниях, вызванных
чувствительной
микрофлорой (туберкулез,
чума, туляремия и др.)

Побочные эффекты

1. Аллергические реакции
2. Нарушение слуха и координации движения
3. Нефротоксичность
4. Нервно-мышечный блок

Форма выпуска

Streptomycin

Флаконы 1,0

Вводят в/м 1-4 раза в
сутки в зависимости от
показаний

Гентамицин

Сходен со стрептомицином

Отличие:

Не применяют при
туберкулезе.

Форма выпуска

Gentamicin

Ампулы 4% - 2 мл, вводят
в/в

Флаконы 0,08 вводят в/м
через 12 часов

Мазь 0,1% - 15,0

Амикацин

Полусинтетический
антибиотик.

Сходен с гентамицином

Отличие:

Проникает через ГЭБ,
накапливается в ликворе

Форма выпуска

Atikasin

Флаконы 0,5

Вводят в/м, в/в через
часов

8

Тетрациклины

Эти антибиотики содержат четыре конденсированных шестичленных цикла.

К ним относят:

Тетрациклин

Доксициклин и др.

Тетрациклин

- Всасывается в ЖКТ
- Накапливается в печени, селезенке, костях и зубах
- Проникает через ГЭБ и плаценту
- В организме не разрушается
- Выделяется с мочой и желчью

Механизм действия тетрациклина

Блокирует связывание
аминоацил-tРНК с
акцепторным участком
рибосомы, подавляют
синтез белка.

Действие
бактериостатическое.

Спектр действия тетрациклина

Активен против грам + и грам – бактерий. К нему чувствительны возбудители дизентерии, брюшного тифа, чумы, туляремии, бруцеллеза, холеры, хламидии и рикетсии.

Устойчивы к тетрациклину: туберкулезная палочка, протей, грибки, вирусы.

Применение тетрациклина

Инфекционные
заболевания,
вызванные
чувствительной
микрофлорой.

Побочные эффекты тетрациклина

1. Гингивит, стоматит, колит
2. Гепатотоксичность
3. Нарушение роста костей и зубов у детей (детям противопоказан)
4. Фотосенсибилизация
5. Суперинфекция
6. Аллергические реакции

Доксициклин

Полусинтетический
антибиотик

Сходен
тетрациклином

с

Отличие от тетрациклина:

1. Большая растворимость в липидах. Полнее всасывается в ЖКТ
2. Меньше связывает кальций
3. Проникает в большинство тканей и жидкостей организма
4. Проникает через плаценту и частично через ГЭБ
5. Биотрансформируется в печени
6. Выделяется с желчью и мочой
7. Способен накапливаться в организме в связи с высокой липофильностью

Форма выпуска

Doxusycline

Капсулы 0,1

Вводят внутрь 1 раз
в день

Макролиды

Макролиды — группа антибиотиков, которые содержат в структуре своих молекул макроциклическое лактонное кольцо, состоящее из 14-16 членов

Классификация

14 – членные

Эритромицин

Кларитромицин

Рокситромицин

15 – членные

Азитромицин

16 – членные

Смирамицин

Джозамицин

Мидекамицин

Медицинское значение

Лечение инфекционных заболеваний, вызванных грамположительными коками и внутриклеточными микробами (микоплазмы, хламидии, кампилобактеры, легионеллы).

Механизм противомикробного действия

Связываются с 50-S субъединицей бактериальной рибосомы и блокируют стадию транслокации растущей пептидной цепи. В итоге прекращается синтез структурных и ферментативных белков микробной клетки.

Характер действия

Бактериостатический
или бактерицидный

Эритромицин

Природный макролид.

Применяется с 1952 г.

Фармакокинетика

Вводят внутрь. Всасывается в кишечнике.

Биодоступность 30-60%.

Связывается с белками плазмы на 70%. Проникает в ткани и жидкости организма, но не проходит через ГЭБ.

Метаболизируется в печени.

Выделяется с мочой.

Спектр противомикробной активности

Активен против грам + коков:

Strep. pneumonie

Strep. pyogenes и др.

Активен против грам - коков:

Neisseria gonorrhoeae

Hemophilus influenzae

Bordetella pertussis

Brucella spp.

Legionella spp.

Bacillus anthracis

Corynebacterium diphtheriae

Активен против анаэробов

Clostridium spp.

Активен против:

Mycoplasma pneumoniae

Chlamydia trachomatis

Spirochaetaceae spp.

Rickettsia spp.

К эритромицину устойчивы

Escherichia coli

Pseudomonas aeruginosa

Shigella spp.

Salmonella spp.

Вирусы, дрожжи, грибки

Применение

Инфекционные
вызванные
микрофлорой:

заболевания,
чувствительной

- Пневмония
- Дифтерия
- Коклюш
- Трахома
- Гонорея
- Сифилис и др.

Побочное действие

1. Диспепсия (активирует рецепторы мотилина)
2. Аллергия
3. Суперинфекция (кандидоз)
4. Мерцательная аритмия и др.

Лекарственная форма

Erythromycin

Таблетки 0,2.

Внутри 4 раза в сутки.

Кларитромицин

Сходен с эритромицином.

Отличие:

1. Полусинтетический макролид второго поколения, более широкий спектр активности.
2. В печени образует активный метаболит (14-гидроксикларитромицин), активный против *Haemophilus influenzae*.
3. Активен против *Helicobacter pylori* (лечение пептической язвы).
4. Активен против *Mycobacterium avium complex*.
Mycobacterium leprae.

Лекарственная форма

Clarithromycin

Синоним: *Klacid*

Таблетки 0,5.

По 1 таблетке внутрь 2 раза
в день через 12 часов.

Азитромицин

Азолидный антибиотик. В составе лактонного кольца содержит атом азота.

Сходен с эритромицином.

Отличие:

1. Полусинтетический макролид.
2. Более широкий спектр активности.

Лекарственная форма

Azithromycin

Синоним: *Sumamed*
Azivok

Таблетки 0,5.

Внутри за час до еды 1 раз в
сутки.

Мидекамицин

Полусинтетический 16-членный макролид последнего поколения.

Сходен с эритромицином.

Отличие:

1. Более широкий спектр активности
2. Активен против стрептококков, устойчивых к 14 и 15-членным макролидам.

Лекарственная форма

Midecatun

Синоним: *Macropen*

Таблетки 0,4.

Внутри за 1 час до еды 3
раза в сутки.

Линкозамиды

К ним относятся:

линкомицин

клиндамицин

По механизму противомикробного действия сходны с макролидами. Связываются а 50-S субъединицей рибосом бактерии. Подавляет синтез белка.

Линкомицин

При введении внутрь биодоступность около 30%. Проникает в различные ткани и полости. Через ГЭБ не проходит. Метаболизируется в печени. Выводится с мочой и желчью.

Спектр действия линкомицина

Грам + микробы

Стрептококки, стафилококки,
пневмококки, возбудители дифтерии.

Анаэробные микробы

Клостридии, бактероиды, микоплазмы.

Неактивен против грам - бактерий,
грибков и вирусов.

Действует бактериостатически и
бактериоцидно.

Форма выпуска

Lincocin

Капсулы 0,25 3 раза в сутки
за 1 час до еды

Ампулы 30% - 1 мл, в/м, в/в
2 раза в сутки.

Клиндамицин

Сходен с линкомицином.

Отличие:

- Большая биодоступность (около 90%).
- Более широкий спектр действия.

Формы выпуска

Clindamycin

Синоним: *Dalacin*

Капсулы 0,15

Ампулы 0,3

Внутрь, в/м, в/в 2-4 раза в сутки

Свечи 0,1 вагинально

Хлорамфеникол

- Быстро всасывается в ЖКТ.
- Биодоступность около 90%.
- Проникает в органы и ткани.
- Проходит через ГЭБ и плаценту.
- Метаболизируется в печени, выделяется с мочой.

Механизм противомикробного действия хлорамфеникола

Связывается с 50S субъединицей бактериальной рибосомы, прекращает: перенос синтезируемой молекулы с Р на А-участок, подавляет синтез белка.

В высоких концентрациях подавляет синтез белка в митохондриях клеток человека.

Спектр действия хлорамфеникола

Грам + и грам - микробы,
риккетсии, микоплазмы,
хламидии, возбудители
кишечных инфекций
(брюшной тиф) и др.

Формы выпуска

Chloramphenicol

Таблетки 0,25 и 0,5 4 раза в
день

Глазные капли 0,25% - 10 мл

Ванкомицин

Гликопептидный антибиотик.

При введении внутрь не всасывается.

Для системного действия вводят в/в.
проникает в различные ткани и
полости.

При менингите проникает через ГЭБ.

Выделяется с мочой.

Механизм действия ванкомицина

Образует комплекс с ацил-D-аланин-D-аланином мукопептида, подавляет образование клеточной стенки.

Действие бактерицидное.

Спектр действия ванкомицина

Активен против грам⁺
бактерий, образующих β -
лактамазу.

На грам⁻ бактерии, грибки,
простейшие и вирусы не
действует.

Форма выпуска

Vancomycin

Флаконы 0,5

в/в через 6 часов

Полимиксин

Полипептидный
антибиотик. При введении
внутрь не всасывается,
создает высокую
концентрацию в
кишечнике.

Механизм действия ПОЛИМИКСИНА

Увеличивает проницаемость
фосфолипидной мембраны,
вызывает лизис бактерий.

Действие бактерицидное.

Спектр действия ПОЛИМИКСИНА

Грам — бактерии, кишечная
группа, синегнойная палочка.

Устойчивы патогенные кокки,
протей, анаэробы,
микробактерии, палочка
дифтерии.

Применение полимиксина

Из-за высокой
нефротоксичности вводят
только внутрь для
стерилизации кишечника.

Форма выпуска

Polimyxin

Таблетки 500 000 ЕД,
внутри через 6 часов

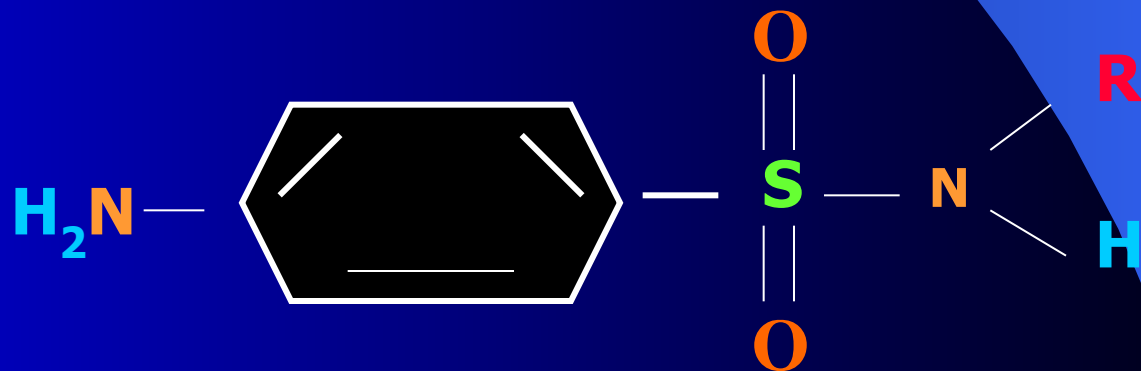
Синтетические противомикробные средства

Классификация синтетических ПМС

- Сульфаниламиды
- Хинолоны
- Фторхинолоны
- Оксихинолины
- Нитрофураны

Сульфаниламиды

Являются производными
сульфаниловой кислоты



Классификация СА

1. СА для системного действия

- Сульфадимедин
- Сульфаэтидол
- Сульфакарбамид
- Сульфадиметоксин
- Сульфаметоксазол

2. СА для действия в просвете кишечника

- Фталилсульфатиазол

3. СА для местного действия

- Сульфацил-натрий
- Сульфадиазин серебра

4. Комбинированные препараты для системного действия

- Котримоксазол

Механизм противомикробного действия СА

СА ингибирует в микробной клетке дигидроптероатсинтазу – фермент, синтезирующий дигидрофолиевую кислоту (ДГФК)

В итоге прекращается образование ДГФК, необходимой для синтеза ДНК и подготовки микробов к делению.

Действие бактериостатическое.

Природа избирательного действия СА

Фолиевая кислота
клетками организма человека не синтезируется, а усваивается как витамин из пищи.

Спектр действия СА

К СА чувствительны:

1. Грамм + и грамм- бактерии:

Кокки, эшерихии, шигеллы, холерный вибрион, клостридии, возбудители сибирской язвы и др.

2. Хламидии, возбудители токсоплазмоза, орнитоза, паховый лимфогранулемы.

3. Простейшие (возбудители токсоплазмоза и малярии)

4. Актиномицеты

СА не действуют на вирусы и туберкулезную палочку

Общие свойства СА для системного действия

Всасываются в ЖКТ.

В плазме крови частично связываются с белками.

Проникают в различные ткани и через ГЭБ (при менингите).

В печени частично инактивируются путем ацетилирования.

Выводятся с мочой. Для профилактики кристаллурии. Необходимо принимать натрия гидрокарбонат и выпивать не менее 2 литров воды.

Новокаин и анестезин снижают противомикробную активность СА, т. к. при их биотрансформации образуется ПАБК.

Понижают возбудимость ЦНС.

Стимулируют секрецию инсулина, снижают содержание глюкозы в крови.

Оказывают мочегонное действие, подавляя реабсорбцию NaCl и H_2O в почечных канальцах.

Сравнительная характеристика СА

Сульфадимедин

Быстро всасывается в ЖКТ
и быстро выделяется с
мочой. Для создания и
поддержания
бактериостатической
концентрации вводят
внутрь по 1,0 6 раз в

Применение сульфадимедина

Инфекционные
заболевания, различной
локализации, вызванные
чувствительной к
препарату микрофлорой

Побочные эффекты сульфадимедина

- Диспепсия
- Кристаллурия
- Угнетение кроветворения
- Аллергическая реакция и др.

Противопоказания для сульфадимедина

- Беременность
- Нарушение функции почек
- Дефицит глюкозо-6-фосфат-дегидрогеназы
- Гиперчувствительность

Форма выпуска

Sulfadimidine

Таблетки 0,5

Внутрь через 4 часа

Сульфазетидол

Отличие:

- Меньше ацетилируется
- Меньше реабсорбируется
- Накапливается в моче в активном виде
- Активен при инфекциях мочевыводящих путей.

Форма выпуска

Sulfaethidole

Таблетки 0,5

Внутрь через 6 часов

Сульфокاربамид

Отличие:

- Выделяется с мочой в активном виде
- Не реабсорбируется
- Активен при инфекциях мочевыводящих путей.

Форма выпуска

Sulfacarbatid

Таблетки 0,5

Внутрь через 6 часов

Сульфадиметоксин

Отличие:

- Быстро всасывается в ЖКТ
- Больше связывается с белками плазмы крови
- Больше реабсорбируется
- Почти не проходит через ГЭБ
- Медленно выделяется из организма
- Вводят 1 раз в сутки

Форма выпуска

Sulfadimethoxine

Таблетки 0,5

Внутрь 1 раз в день по 1,0

Котримоксазол

Комбинированный препарат, который содержит сульфаметоксазол (сульфаниламид) и триметоприм (производные пиридина) – ингибитор ДГФК – редуктазы, которая превращает ДГФК в ее активную форму ТГФК.

Действие бактерицидное.

Спектр действия широкий.

Форма выпуска

Co-trimoxazole

Синоним: *Biseptol*

Таблетки 480 и 120 мг

Внутрь 2 раза в сутки.

Сульфаниламиды для действия в просвете кишечника

Фталилсульфатиазол

- В ЖКТ не всасывается.
- Является пролекарством.
- Активируется после отщепления фталата и превращается в норсульфазол – активный СА.

Применяют при кишечных инфекциях, которые чувствительны к СА.

Форма выпуска

Phthalylsulfathiazole

Таблетки 0,5

Внутрь через 6 часов

Сульфаниламиды для местного применения

Сульфацил натрия

Хорошо растворяется в воде.

Применяют в виде глазных
капель при инфекционных
заболеваниях глаз
(конъюнктивит, блефарит, язва
роговицы).

Форма выпуска

Sulfacetamid sodium

Г.К. 30% - 10 мл

По 2 капли в оба глаза
через 4 часа.

Сульфадиазин серебра

Противомикробное действие сульфадиазина усиливается антисептическим действием серебра.

Применяют для лечения инфицированных ожогов и ран в виде мази.

Форма выпуска

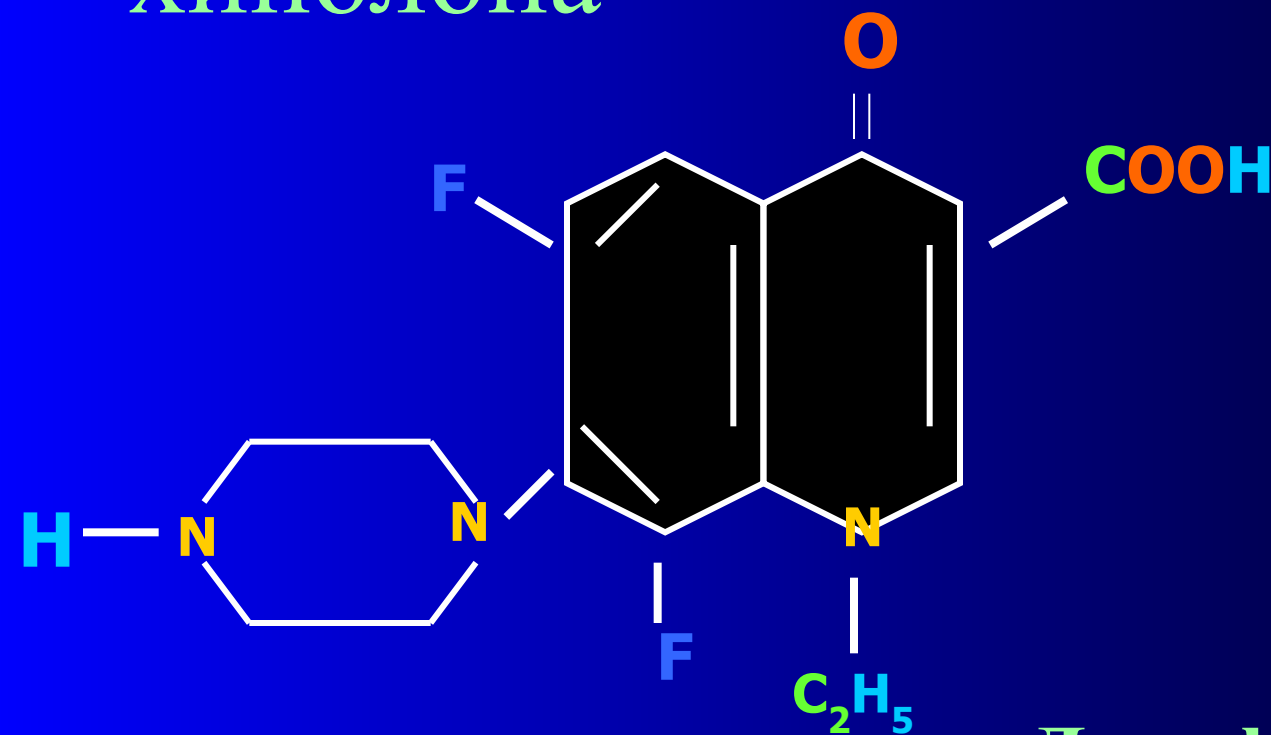
Silver Sulfadiazine

Мазь 1 % - 50,0

Местно для лечения
ожогов и ран.

Фторхинолоны

Синтетические ПМС производные
хинолона



Ломефлоксацин

Классификация ФХ

1-е поколение

Ципрофлоксацин

Офлоксацин

Норфлоксацин

2-е поколение

Ломефлоксацин

Общая характеристика ФХ

1. Вводят внутрь или В/В
2. Быстро всасываются в ЖКТ
3. Биодоступность около 95%
4. Мало связываются с белками плазмы крови
5. Проникают во все ткани, в мокроту, слюну, желчь, молоко, секрет предстательной железы
6. Проникают через ГЭБ
7. Почти не метаболизируются
8. Выделяются до 90% с мочой в активном виде.

Механизм противомикробного действия ФХ

Ингибируют ДНК-гиразу микробной клетки — фермент, который контролирует структуру и функцию бактериальной ДНК.

Действие бактерицидное

Спектр действия ФХ

Являются ПМС широкого спектра действия.

Активны против грам+ и грам- бактерий.

Действуют на гонококков, эшерихий, шигелл, сальмонелл, клебсиелл, энтеробактер, гемофилюс, синегнойную палочку, микоплазмы, хламидии.

Ломефлоксацил подавляет развитие возбудителей туберкулеза.

Применение ФХ

Инфекционные заболевания, вызванные чувствительной к ФХ микрофлорой.

1. Инфекции кожи и мягких тканей.
2. Инфекции дыхательных путей, бронхиты, пневмонии.
3. Инфекции ЖКТ (дизентерия, брюшной тиф и др.)
4. Инфекции мочевыводящих и половых путей (пиелит, цистит, простатит, гонорея).
5. Инфекции органов брюшной полости, гинекологические инфекции.
6. Инфекционное поражение глаз.
7. Сепсис.
8. Туберкулез .

Побочные эффекты

1. Диспепсия.
2. Головная боль.
3. Беспокойство, судороги (антагонисты ГАМК).
4. Угнетение кроветворения.
5. Нарушение роста и развития хрящевой ткани (в эксперименте на животных)
6. Аллергия.

Противопоказания

1. Беременность.
2. Кормление грудью.
3. Дети до 15 лет.
4. Эпилепсия (обострение).
5. Гиперчувствительность

Форма выпуска

Ofloxacin

Синоним: *Tarivid*

Таблетки 0,2

Внутрь через 12 часов

Формы выпуска

Norfloxacin

Синоним: *Nolicin*

Таблетки 0,4 через 12 часов при инфекциях мочевыводящих путей. Системного противомикробного действия не оказывает т.к. быстро выделяется с мочой.

Глазные капли 0,3% - 5 мл закапывают 6 раз в сутки

Формы выпуска

Ciprofloxacin

Синоним: *Ciprobay*

Таблетки 0,25-0,5-0,75 через 12 часов

Флаконы 0,2% -50 или 100 мл в/в
через 12 часов

Глазные капли 0,35 – 5 мл до 6 раз в
сутки.

Форма выпуска

Lomefloxacin

Синоним: *Lomflox*

Таблетки 0,4
через 24 часа

Производные нафтиридина

Кислота налидинсовая

Вводят внутрь. Всасывается в ЖКТ. Частично

метаболизируется в печени.

Быстро выводится с мочой,

где создает высокие

концентрации активного

вещества. $T_{1/2}$ около 1-2 часов.

Ингибирует ДНК-гиразу
бактерии, угнетает синтез ДНК.

Действует бактерицидно или
бактериостатически на грам-
микробов.

Активна против *E. colim* *Proteus*,
Klebsiela, *Enterobacter*, *Shigela*.

Не активна против *Pseudomonas*.

Показания

1. Инфекции мочевого тракта
2. Бактериальная дизентерия

Для лечения инфекций тканей и органов не применяют, т.к. в тканях не создаются подавляющие концентрации в связи с быстрым выделением из организма.

Противопоказания

1. Гиперчувствительность к препарату
2. Эпилепсия
3. Беременность
4. Кормление грудью
5. Младенческий возраст
6. Нарушение функции печени и почек.

Побочные эффекты

1. Нейртоксичность (нарушение сознания, психоз, судороги).
2. Тошнота, рвота.
3. Головокружение, головная боль.
4. Желтуха.
5. Лейко- и тромбоцитопения.
6. Аллергия.

Форма выпуска

Nalidixic acid

Синоним: *Negram*

Таблетки 0,5 внутрь
через 6 часов.

Производные оксихинолина

Нитроксолин

Вводят внутрь.

Быстро всасывается в ЖКТ и быстро выделяется с мочой, создавая в моче высокие концентрации активного вещества.

Механизм действия

1. Угнетает синтез ДНК бактерий.
2. Действует бактериостатически.

Широкий спектр противомикробного действия

Активен против грам+ микробов:

Staphylococcus, Streptococcus, Enterococcus faecalis, Corynebacterium diphtheriae, Bacillus subtilis.

Против грам- бактерий:

Neisseria gonorrhoeae, E.coli, Proteus, Klebsiella, Salmonella, Shigella, Enterobacter.

Эффективен против Mycobacterium tuberculosis, Trichomonas vaginalis, Candida.

Показания

1. Инфекции мочевого тракта, вызванные чувствительными возбудителями.
2. Профилактика инфекций мочевого тракта при диагностических исследованиях.

Противопоказания

1. Гиперчувствительность к препарату.
2. Беременность.
3. Кормление грудью.
4. Олигурия.

Побочные эффекты

1. Тошнота, рвота.
2. Потеря аппетита.
3. Тахикардия.
4. Атаксия.
5. Головная боль.
6. Парестезии.
7. Нейропатия.
8. Нарушение функции печени.
9. Аллергия.

Форма выпуска

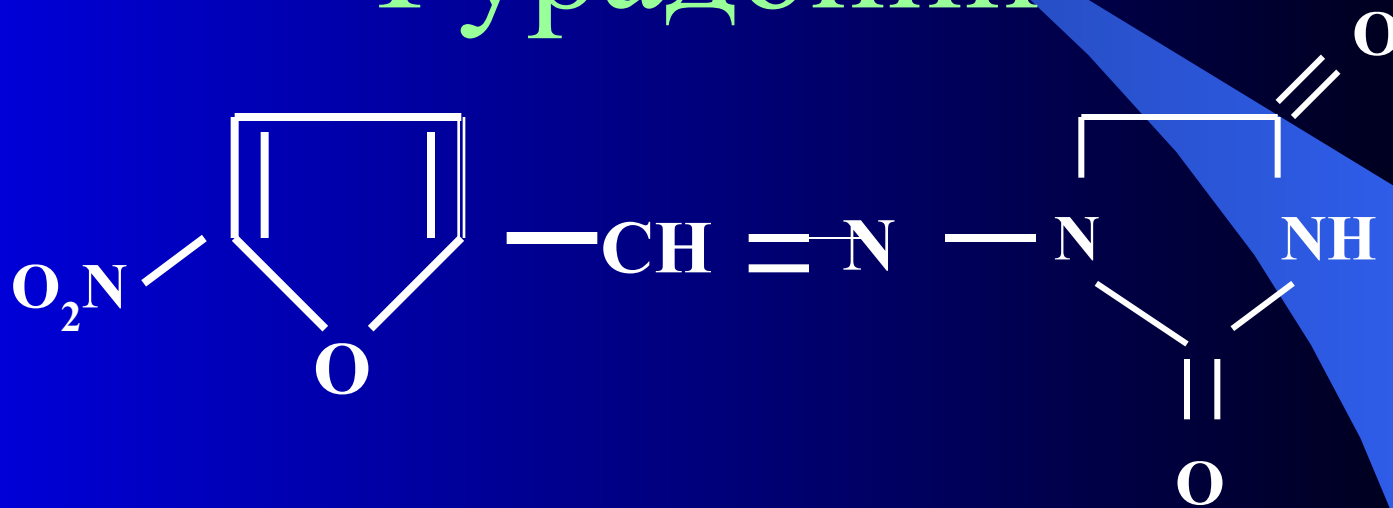
Nitroxolin

Синоним: *5-NOK*

Таблетки 0,5 вводят
внутрь 4 раза в сутки

Производные нитрофурана

Фурадонин



При введении внутрь:

Быстро всасывается из ЖКТ.

Проникает во все ткани.

В печени превращается в
аминопроизводное

Выделяется почками и кишечником

Применяют при инфекциях ЖКТ и
мочевыводящих путей.

Механизм противомикробного действия фурадонина

Ингибирует синтез ДНК, РНК и
белков в микробной клетке.

Угнетает аэробный метаболизм.

Действие бактерицидное.

Спектр действия фурадонина

Включает грам⁺ и грам-
бактерии.

Он активен против коков,
эшерихий, возбудителей
брюшного тифа, дизентерии и
др.

Побочные эффекты

1. Диспепсия
2. Потеря аппетита
3. Гепатотоксичность
4. Нейротоксичность
5. Нарушение кроветворения
6. Аллергия

Противопоказания

1. ХПН
2. Дефицит Г-6-фосфатдегидрогеназы
3. Детям до 1 года
4. Гиперчувствительность

Форма выпуска

Furadonine

Синоним: *Nitrofurantoin*

Таблетки 0,05 и 0,1

через 6 часов

Фуразолидон

Сходен с фурадонинном

Форма выпуска

Furazolidone

Таблетки 0,05 через 6
часов

Благодарю за
внимание!