

**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. $\beta$ -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.  $\beta$ -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  $\beta$ -лактамазами устойчивых микробов

# Спектр противомикробного действия БП

- Действует на грам + бактерии, которые не образуют  $\beta$ -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  $\beta$ -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  $\beta$ -лактамазы  
микробов)

Вводят внутрь через 8 часов

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

Вводят в/в через 8 часов

0,1

# 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  $\beta$ -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  $\beta$ -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  $\beta$ -  
лактамазе

Отличие от БП:

1. Активен против стафилококков, образующих  $\beta$ -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  $\beta$ -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 грамположительных бактерий и синегнойной палочки
3. Устойчив к  $\beta$ -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  $\beta$ -лактамазе

Форма

ВЫПУСКА

*Сеферіте*

Флаконы 1,0

Вводят в/м, в/в через

12 часов

# Карбапенемы

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

К ним относят имипенем и меропинем.



# Имипенем

- В ЖКТ не всасывается
- Вводят в/в
- Устойчив к  $\beta$ -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, гемофильюсы, клебсиеллы, морганеллы, пептококки, протей, синегнойная палочка, стрептококки и стафилококки.

# Форма выпуска

## *Tienam*

Комплексный препарат

Флакон содержит 0,5  
имипенема и 0,5 циластатина

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

# Монобактамы

К этой группе относят азтреонам – антибиотик, у которого  $\beta$ -лактамное кольцо не конденсировано с гетероциклом.

# Азтреонам

- Вводят в/м и в/в через 6 часов
- Устойчив к  $\beta$ -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

*Amikacin*

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 своей структуре 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. pneumoniae*

*Strep. pyogenes* и др.

Активен против грам - коков:

*Neisseria gonorrhoeae*

*Haemophilus 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.

Внутрь 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

*Midecatin*

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

## *Линсомисин*

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<sup>+</sup>  
бактерий, образующих  $\beta$ -  
лактамазу.

На грам<sup>-</sup> 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

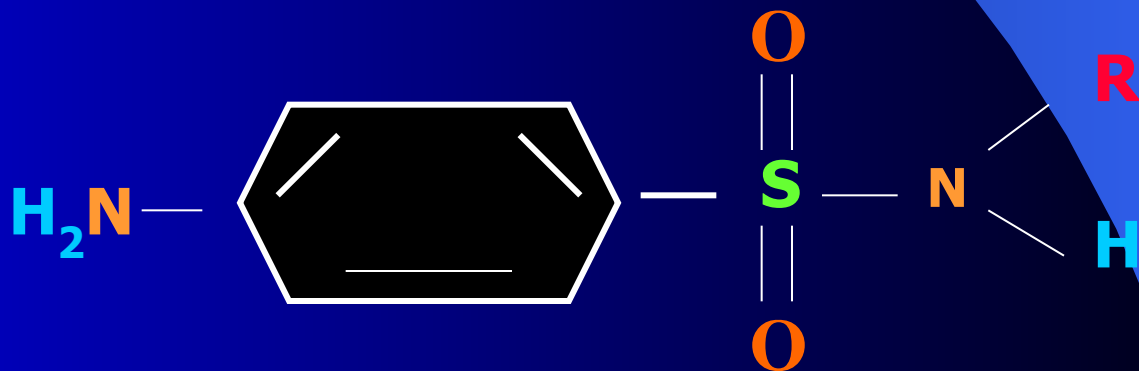
Синтетические  
противомикробные  
средства

# 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  $\text{NaCl}$  и  $\text{H}_2\text{O}$  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 г 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

Внутри через 6 часов

# Сульфокварбамид

## Отличие:

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



**Форма выпуска**

*Sulfacarbamid*

Таблетки 0,5

Внутри 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

Внутри 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

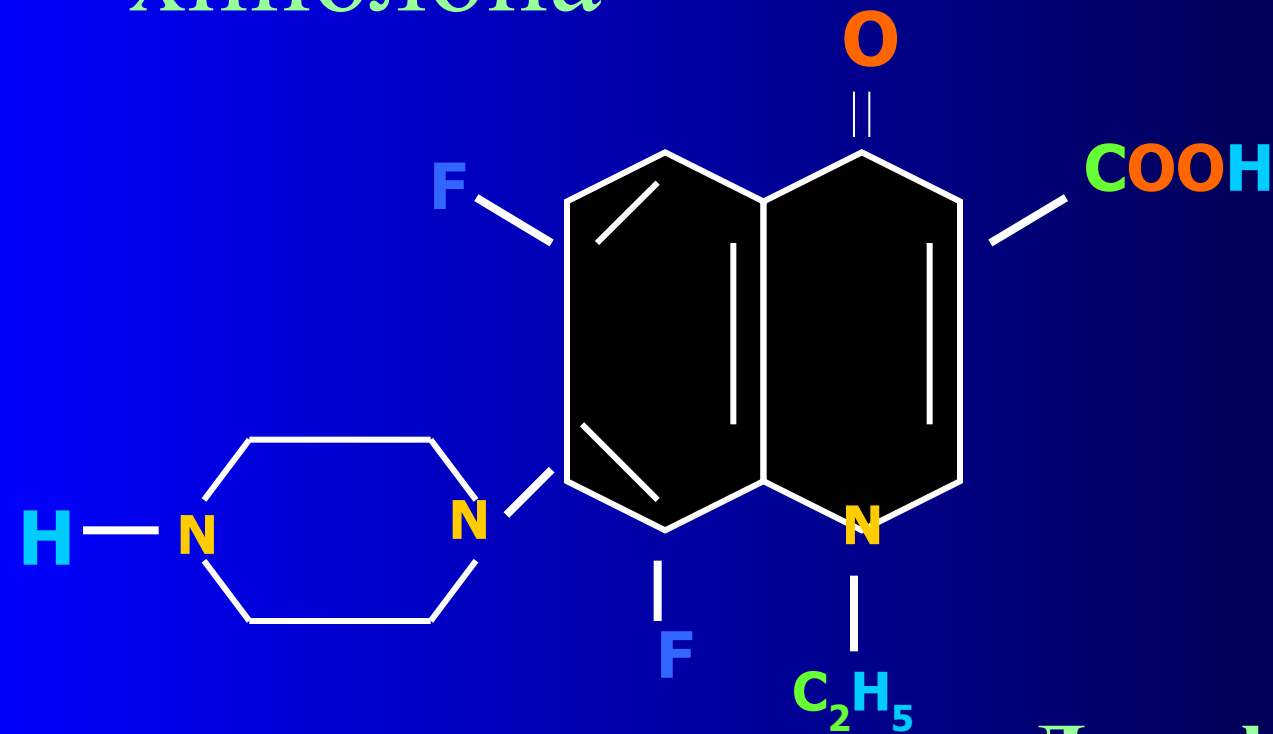
*Silver Sulfadiazine*

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

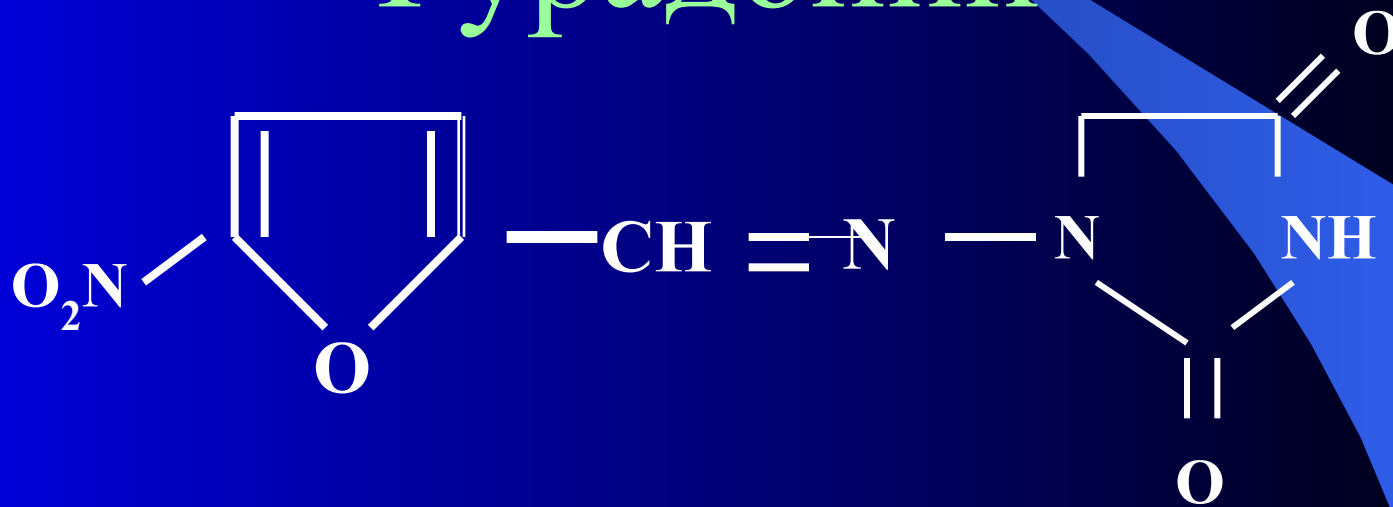
*Nitroxolin*

Синоним: **5-NOK**

Таблетки 0,5 вводят  
внутри 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<sup>+</sup> 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!