

АО «МЕДИЦИНСКИЙ УНИВЕРСИТЕТ  
АСТАНА»  
КАФЕДРА ОБЩЕЙ ФАРМАКОЛОГИИ

СРС

Тема: «Противопротозойные средства»

Выполнили: Шуканова С. и Абраева А. (356 ОМ)

Проверила: Жусупова Гульнара Даригеровна

Астана 2017

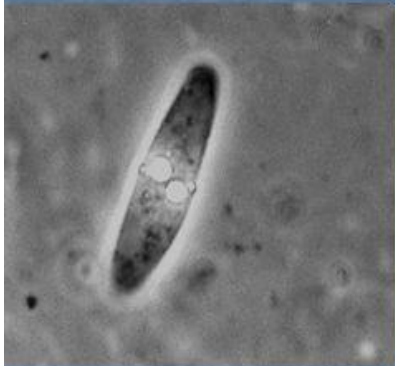
# ПЛАН

- Определение
- Классификация
- Противомаларийные препараты
- Средства для лечения амебиоза
- Средства для лечения лямблиоза
- Средства для лечения трихомоноза
- Заключение

# Противопротозойные средства

- это фармакологические вещества, которые губительно действуют на патогенных простейших.

# Простейшие



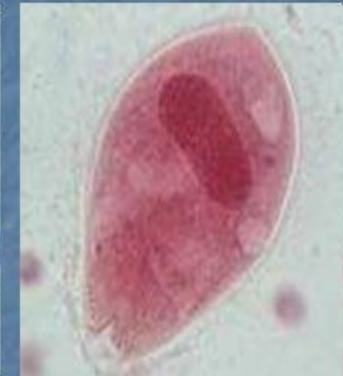
Plasmodium



Toxoplasma gondii



Entamoeba



Balantidium coli



Leishmania



Lamblia intestinale



Trypanosoma



Trichomonas

# ПРОТИВОПРОТОЗОЙНЫЕ СРЕДСТВА

- Противомаларийные средства: **хингамин, хинин, хлоридин, примахин, мефлохин, сульфаниламиды, сульфоны**
- Противоамебные средства: **метронидазол, хингамин, эметина гидрохлорид, хиниофон, тетрациклины**
- Противолямблиозные средства: **метронидазол, фуразолидон, акрихин.**
- Противотрихомонадные средства : **метронидазол, тинидазол, трихомонацид, фуразолидон**
- Противотоксоплазмозные средства : **хлоридин, сульфадимезин**
- Ср-ва для леч-я балантидиаза: **хиниофон, тетрациклины, мономицин**
- Ср-ва для леч-я лейшманиоза : **солюсурьмин, натрия стибоглюконат, метронидазол, глюкантим**

# ПРОТИВОМАЛЯРИЙНЫЕ СРЕДСТВА

- Гематошизотропные ср-ва: *хингамин, хинин хлоридин, акрихин, бигумаль, сульфаниламиды*
- Гистошизотропные ср-ва: *хлоридин, примахин*
- Гамонтотропные ср-ва: *хлоридин, хиноцид, примахин, бигумаль*



# Противомаларийные средства



## Хинолины:

- хинин,
- хингамин,
- гидроксихлорохин,
- акрихин,
- мефлохин,
- примахин.

## Пиримидины:

- хлоридин,
- триметоприм.

# ХИНГАМИН

Быстро вызывает гибель бесполой эритроцитарной формы плазмодиев. Является высокоактивным препаратом. Устойчивость плазмодиев к препарату развивается медленно. Из ЖКТ всасывается быстро и полно. 50% связывается с белками плазмы. Из организма выводится медленно.  $T_{1/2} = 3$  сут. 70% препарата выделяется мочой в неизмененном виде. Хингамин угнетает синтез нуклеиновых кислот и активность ряда ферментов. При лечении малярии (кратковременное применение внутрь или в/в) препарат не вызывает побочных явлений. Но так как хингамин обладает и иммуносупрессивным действием, то назначается также при коллагенозах, амилоидозах, аритмиях длительно (3-6 мес). В этом случае вызывает побочные эффекты.



# ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ ХИНГАМИНА

Дерматит, головная боль, головокружение, диспепсия, шум в ушах, нарушение зрения и аккомодации, отложение пигмента в глазах, лейкопения. В больших дозах: гепатит, миокардит, поседение волос, ретинопатия. Быстрое в/в введение может вызвать коллапс.

П/пок-я: тяжелые поражения сердца, нарушение ф-ции почек и печени, поражение кроветворных органов.

# ХЛОРИДИН

Угнетает дегидрофолатредуктазу и нарушает обмен дегидрофолиевой к-ты в орг-зме плазмодия. Д-вует относительно медленно и продолжительно (2 нед). Активен в отнош-и бесполой, презитроцитарных и половых форм всех видов плазмодиев. Выделяется с молоком. К хлоридину быстро развив-ся устойчивость плазмодиев. П.э., его прим-ют в сочетании с сульфаниламидами. Длит-сть курса леч-я 3 дня. Побоч-е эф-ты: гол-я боль, г/кружение, диспепсия, боли в обл. сердца, мегалобластическая анемия, тератогенное д-е. П/пок-н при патологии кроветворной с-мы и почек.

# ХИНИН

Хинин - алкалоид коры хинного дерева. Быстро купирует острые лихорадочные приступы малярии. Избирательно действует на шизонты, но не действует на гамонты. Назначается внутрь. Из ЖКТ всасывается медленно. Малоактивен. Угнетает активность дыхательных ферментов плазмодия и приводит к дефициту энергии. Угнетает ЦНС, уменьшает возбудимость и сократимость миокарда, усиливает сокращения матки и селезенки. Высоко токсичен, вызывает много побочных эффектов. Применяется в основном при малярийной комме в случае устойчивости плазмодия к хингамину и др. п/малярийным средствам (в/в).

# АКРИХИН

Синтетический, слабо и непродолжительно действующий п-т. По характеру п/мал-го д-я сходен с хинином: губит-но д-вует на шизонты и мерозоиты всех видов плазмодиев, но на параэритроцитарные формы и гамонты не влияет. Быстро всасывается из ЖКТ. Медленно разрушается и выделяется, п.э. длит-но задержив-ся в орг-зме. Применяется внутрь после еды. При маляр-й коме - в/в, в/м. Акрихин мало токсичен, поб-е эф-ты редки. Окрашивает кожу и слизистые, кроме склер, в желтый цвет (1-2 нед.). Иногда акрихин выз-ет двигат-е и речевое возбужд-е с потерей ориентации (“акрихин-е опьянение”) или “акрих-й психоз”-галлюцинации, возбужд-е или депрессия.

# БИГУМАЛЬ

П/маляр-й эф-кт оказыв-т метаболиты. Д-вует на все виды плазмодиев. При этом шизонты тропической малярии к нему более чувств-ны, чем к хингамину. Пр-т угнетает способность гамонтов к дальнейшему развитию в орг-ме комара (споронтоцидное д-е). М-зм д-я: угнетает обмен фолиевой к-ты в плазмодиях. Хорошо всасыв-ся из ЖКТ. Устойч-сть к нему плазмодиев развив-ся быстро. Прим-тся гл.о. для обществ-й проф-ки и леч-я тропич-й малярии. При длит-м прим-и угнетает аппетит. В Тd поб-е эф-ты не вызывает. Недостатки: медленное д-вие, быстрое выведение из орг-ма, быстрое развитие к нему устойчивости плазмодиев.



Гематошизотропная акт-сть сульфаниламидов и сульфонон (Дапсон) невелика. Их действие развивается медленно. П.э. их назначают в сочетании с другими п/маляр-ми препаратами.

# ПРИМАХИН

Губительно влияет на параэритроцитарные формы всех видов плазмодиев, на половые формы, шизонты. Из ЖКТ всасывается хорошо. Быстро метаболизируется, метаболиты выделяются почками в течение первых суток. Применяют для профилактики отдаленных рецидивов и для личной (в сочетании с хингамином) и общественной профилактики. Хорошо переносится б-ными. Но м.б. боли в животе и обл. сердца, диспепсия, цианоз (метгемоглобинемия), общая слабость. Нельзя назначать примахин одновременно с акрихином (т.к. примахин задерживается и увеличивается его токсичность) и в ближайшие сроки после применения акрихина (промежутков не менее 1 месяца).

# ХИНОЦИД

Избират-но д-вует на параэритроцитарные и половые формы маляр-го плазмодия. Прим-ют для проф-ки отдаленных рецидивов 3-х и 4-х дневной малярии и для предупреждения проявлений этих форм малярии после прекращ-я личной х/проф-ки при имевшем место высоком риске заражения. Поб-е эф-ты:небольшой гемолиз, цианоз губ и ногтевого ложа, лейкопения или лейкоцитоз, лихорадка, диспепсия, головная боль, явл-я раздраж-я почек и мочевого пузыря. Хиноцид нельзя назн-ть одноврем-но с др-ми п/маляр-ми п-тами, т.к.увел-ся токсичность.

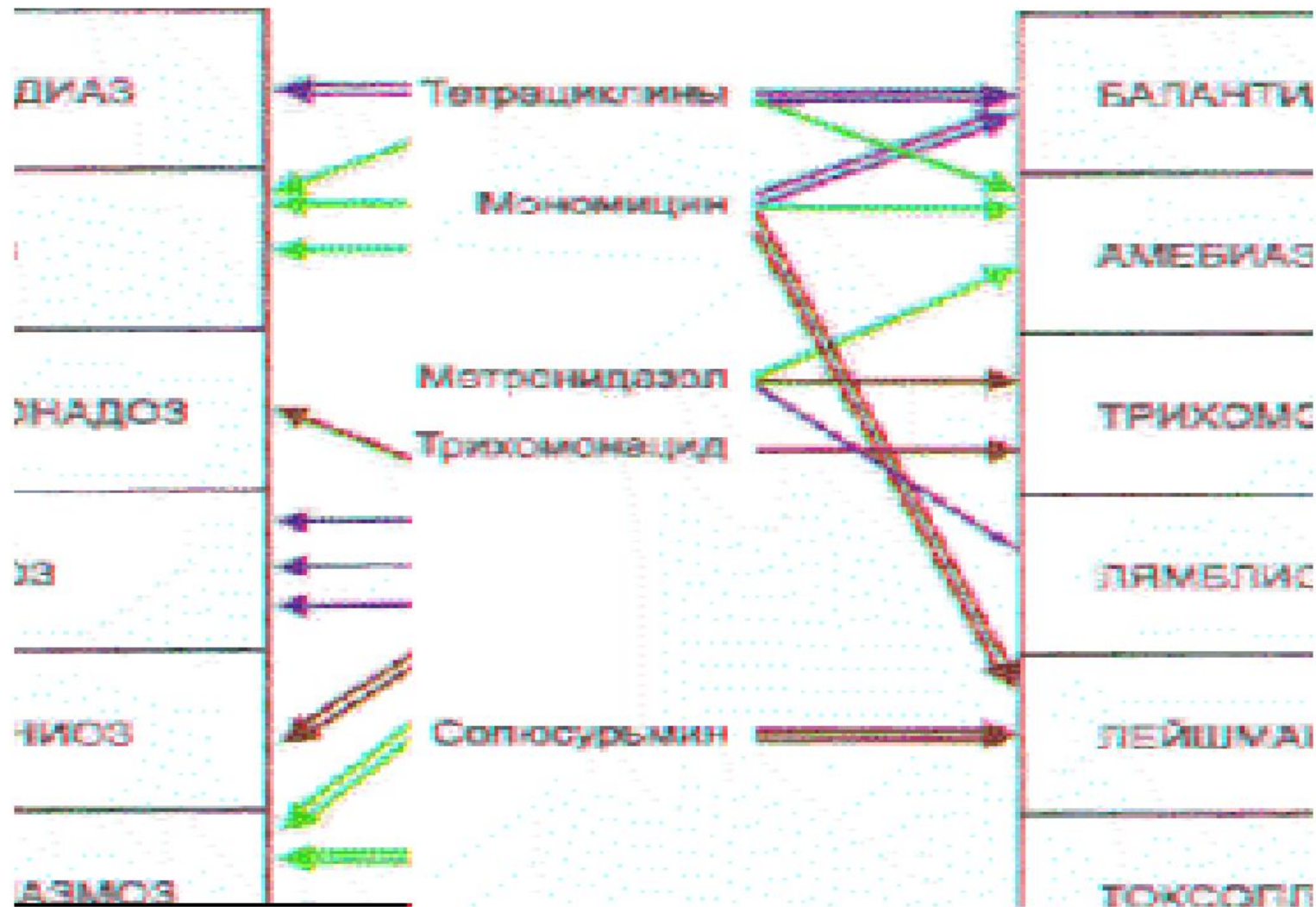
# Комбинированные противомаларийные препараты

- **Метакельфин**  
(хлоридин+сульфален),
- **Фансидар**  
(хлоридин+сульфадоксин).

# ПРИНЦИПЫ ИСПОЛЬЗОВАНИЯ ПРОТИВОМАЛЯРИЙНЫХ СРЕДСТВ

- Личная химиопрофилактика (испол-ют п-ты, влияющие на презэритроцитарные формы плазмодиев)- *хингамин, хлоридин*.
- Лечение малярии (гематошизотроп-е ср-ва) - *хингамин, хлоридин, акрихин, бигумаль*
- Профилактика рецидивов (испол-ют п-ты, действ-е на параэритроцитарные формы) - *примахин*
- Общественная химиопрофилактика (гамонтотропные ср-ва)- *примахин, хлоридин*





# СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ АМЕБИАЗА

- Амёбициды прямого д-вия, эффект-е преимущественно при локализации амёб в просвете кишечника: ***хиниофон, энтеросептол***
- Амёбициды непрямого д-я, эффект-е при локализации амёб в просвете и стенке кишечника: ***тетрациклины***
- Тканевые амёбициды, д-е на амёб в стенке кишечника и в печени: ***эметина гидрохлорид***
- Тканевые амёбициды, эффект-е преимущественно при локализации амёб в печени: ***хингамин***
- Амёбициды, эффект-е при любой локализации патологического процесса: ***метронидазол***

# МЕТРОНИДАЗОЛ

Облад-т широким спектром д-вия в отнош-и простейших. Подавляет размнож-е амёб, трихомонад, лямблий и анаэробных микробов. Быстро всасывается из ЖКТ. Выводится почками, небольшое кол-во слюнными, молоч-ми ж-зами, с желчью, кишеч-ком. Назн-ют внутрь и местно. П/э: диспепсия, тремор, наруш-е координации, кандидамикоз. Окрашивает мочу в красно-коричневый цвет. П/пок-ния: беременность, в период лактации, наруш-я кроветворения, активные заб-я ЦНС. Во время леч-я п-том нельзя алкоголь.

# ТИНИДАЗОЛ

По структуре и фармакодинамике близок к метронидазолу, но в плазме создаются более высокие концентрации тинидазола и он действует продолжительнее. Хорошо всасывается из ЖКТ. Оказывает бактерицидное действие в отношении ряда облигатных анаэробов. Применяют при амёбной дизентерии, трихомонадозе и лямблиозе.

# ХИНИОФОН

Тормозит акт-сть нек-рых ферментов амёб. Не д-вует на амёбы, находящиеся в глубине тка-ней кишечной стенки, но освобождает от них содержимое кишеч-ка и поверхность слизис-той. Хиниофон прим-т для завершения леч-я амёбной дизентерии и для устранения амёбо-носительства. Назн-ют внутрь или в клизмах в теч-е 8-10 дней. П-т малотоксичен. П/э-ты: диарея, неврит зрит-го нерва.



# ЭМЕТИНА ГИДРОХЛОРИД

Алкалоид корня ипекакуаны. При приеме внутрь вызывает рефлекторно рвоту и диарею. Назначается в/м. П-т д-вует на амёбы, локализованные внекишечно и в стенке кишечника. Из ор-зма выделяется медленно. Кумулирует. Токсичен. М.б. диарея, диспепсия, наруш-я со стороны ССС, нервно-мышечной с-мы, печени, почек. Показан при острых формах дизентерии для купирования болей, лихорадки, диареи, а также при внекишечном амебиазе. Д-вует амебостатически. П/пок-н при органических заб-х сердца и почек.

# СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ЛЯМБЛИОЗА

- ◎ **Метронидазол**
  - ◎ **Акрихин**
- ◎ **Фуразолидон**
- ◎ **Аминохинол**

# АМИНОХИНОЛ

При лямблиозе п-т назнач-т внутрь после еды циклами по 5 дней, с перерывами между ними 4-7 дней. В отличие от акрихина не вызывает окрашивание кожи. Редко п/э: диспепсия, головная боль, снижение аппетита. При передозировке: бессонница, шум в ушах, общ. слабость. При аллергии п-т отменяют. Аминохинол также применяют при лейшманиозе, токсоплазмозе, системных коллагенозах, неспецифич-м язвенном колите.

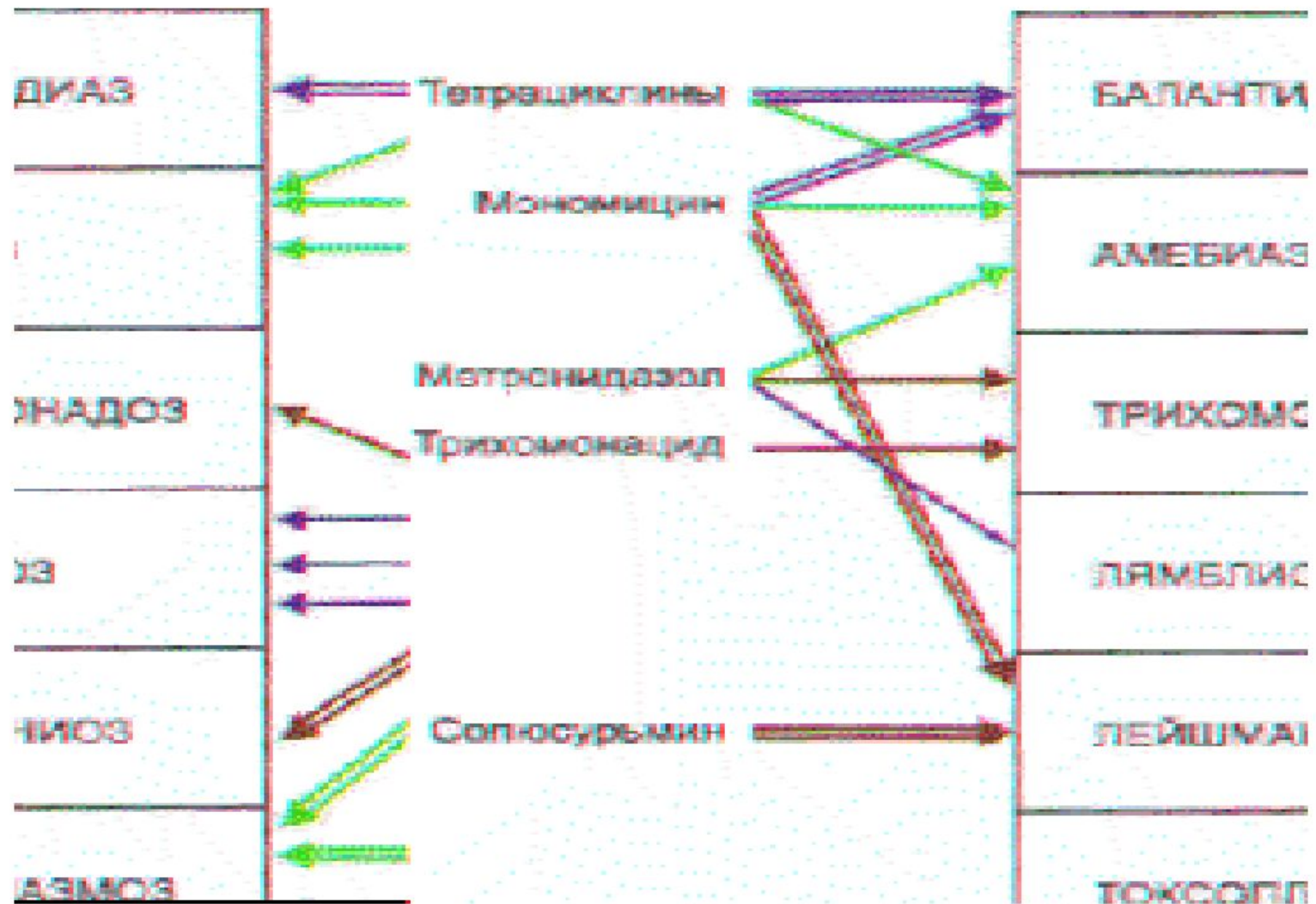
# СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ТРИХОМОНАДОЗА

- **Метронидазол**  
**Тинидазол**
- **Трихомонацид**
- **Фуразолидон**

# ТРИХОМОНАЦИД

Производное хинолина, высоко активен в отношении трихомонад. Применяется для лечения урогенитальных заболеваний у мужчин и женщин, вызванных *Trichomonas vaginalis*. Назначают внутрь (после еды в 2-3 приема) и местно в течение 5-6 дней. Курс лечения можно повторить через 10-20 дней. Трихомонацид в больших дозах оказывает раздражающее действие на слизистые оболочки: обильные выделения из влагалища и уретры.





# СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ЛЕЙШМАНИОЗА

- ◉ **Мономицин**
- ◉ **Акрихин**
- ◉ **Солюсурьмин**
- ◉ **Аминохинол**
- ◉ **Глюкантим**

# СОЛЮСУРЬМИН

Содержит 21-33% пентавалентной сурьмы. Применяют при висцеральном лейшманиозе в/в ежедневно, без перерывов, согласно схеме, 2-3 недели. Также назначают для лечения хронического кожного лейшманиоза, особенно его туберкулоидной формы. Осложнения: вторичная бактериальная инфекция, для предупреждения одновременно назначают антибиотики или сульф-ламиды. Противопоказания: сопутствующее острое инфекционное заболевание, значительная дистрофия, интоксикация, тяжелые поражения внутренних органов.

# Г Л Ю К А Н Т И М

П-т пяти валентной сурьмы. При висцеральном лейшманиозе вводят в/м 30% р-р по 5 мл в амп., при кожном лейшманиозе - местно. Леч-е проводят по схеме, е/д, на 1 курс 10-15 инъекций. Поб-е эф-ты: лихорадка, диспепсия, кашель. П/пок-я: туберкулез, сердечная, почечная, печеночная недостаточность.