

Химиотерапевтические средства

Классификация средств для борьбы с живыми возбудителями заболеваний

- 1. Дезинфицирующие.**
- 2. Антисептические.**
- 3. Химиотерапевтические.**

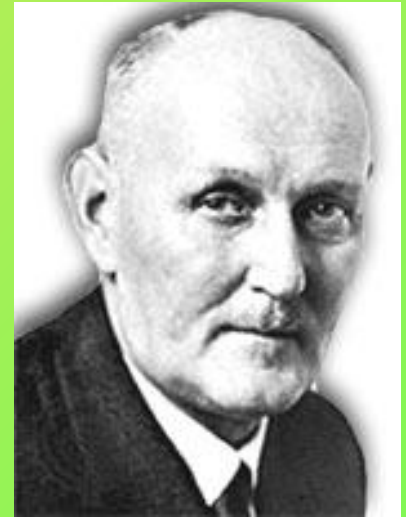
Классификация

химиотерапевтических средств

- 1) Сульфаниламиды
- 2) Нитрофураны
- 3) Фторхинолоны
- 4) 8-оксихинолины
- 5) Антибиотики
- 6) Противотуберкулезные средства
- 7) Противосифилитические средства
- 8) Противомаларийные препараты
- 9) Противопротозойные средства
- 8) Противогрибковые средства
- 9) Антигельминтные препараты
- 0) Противовирусные препараты

Сульфаниламидные препараты

Производные сульфаниловой кислоты



Гергард Домагк

В 1932 г. Открыл пронтозил – красный стрептоцид. В 1936 г. – в моче больных получавших пронтозил обнаружен активный метаболит – белый стрептоцид – сульфаниламид.

Спектр этиотропного действия

Стрептококки, гонококки, палочки мягкого шанкра, пневмококки, сибирская язва, дизентерия.

Не чувствительны: кишечная палочка, протей, золот. стафил., риккетсии, спирохеты

Механизм действия сульфаниламидов (СА)

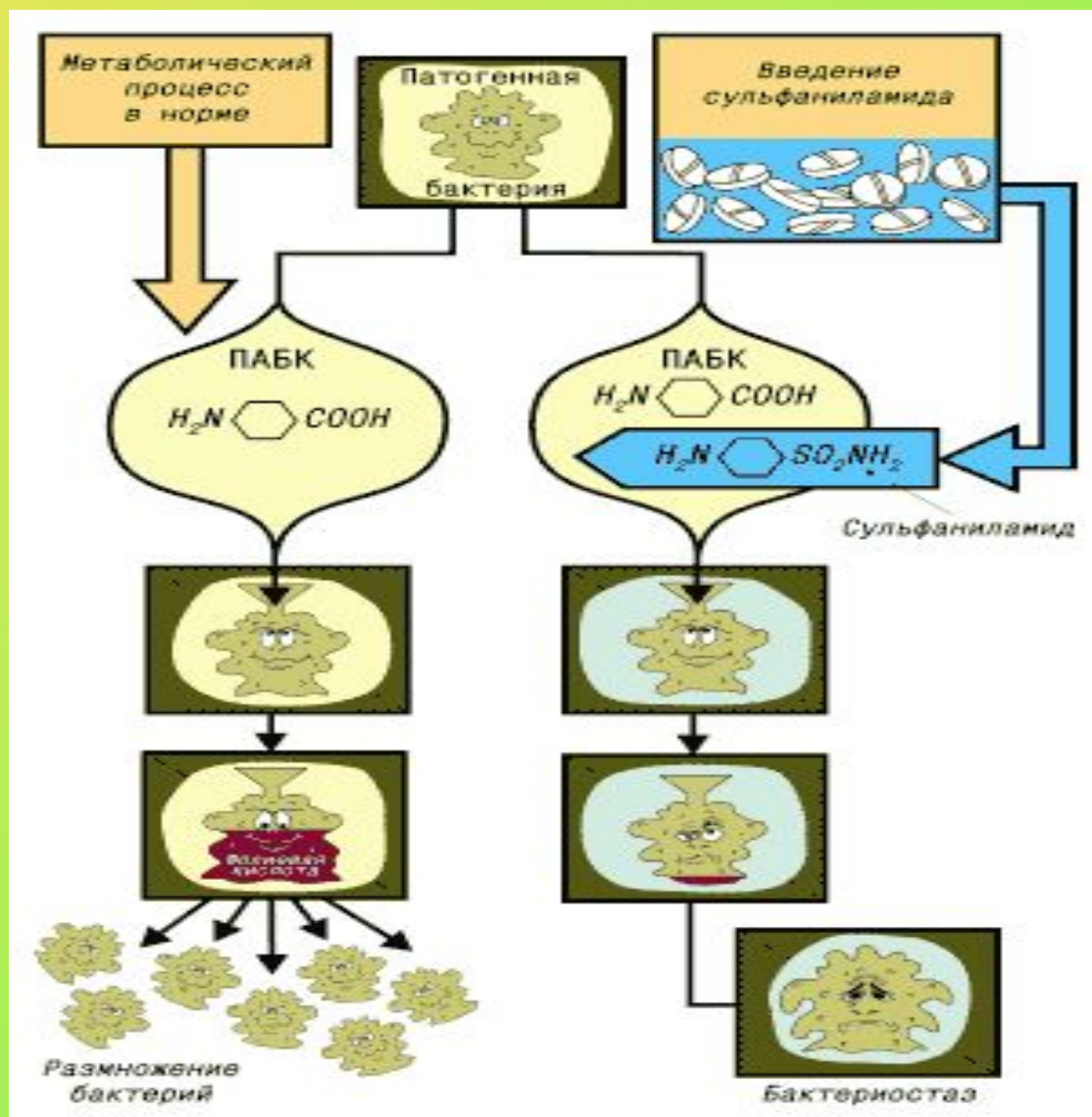
1940 г. Вудс и Финдс

Структура сульфаниламида.

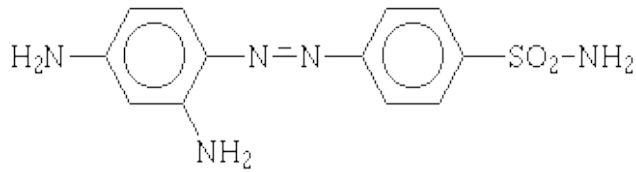
**ПАБК (парааминобензойная кислота) –
предшественник фолиевой кислоты
(ФК).**

**Механизм действия СА основан на
конкурентном антагонизме с ПАБК →
нарушается синтез ФК в микробной
клетке. Кроме этого, угнетение усвоения
глутаминовой кислоты, угнетение
синтеза никотиновой кислоты, составной
части кофермента А.**

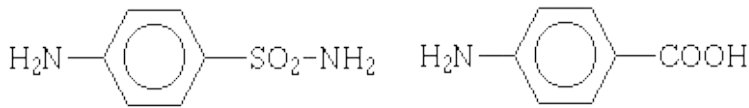
Механизм действия СА



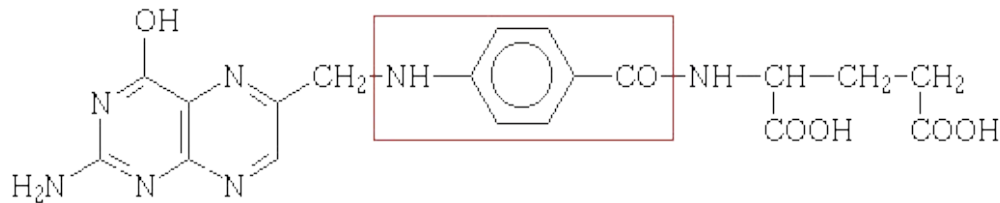
Механизм действия СА



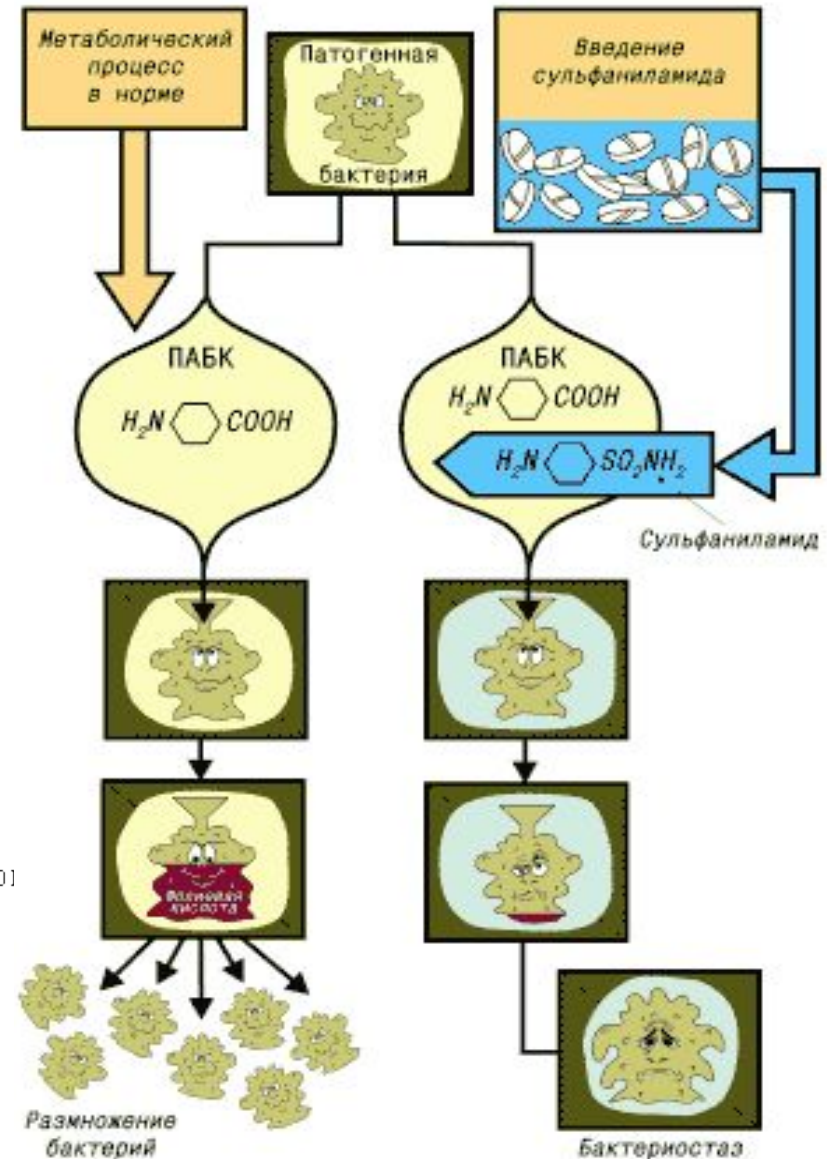
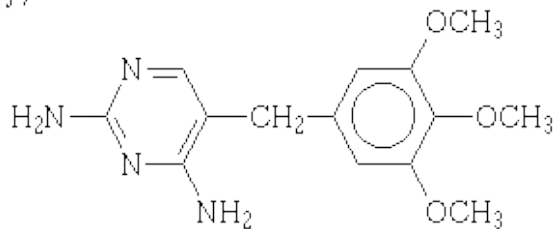
Пронтозил (красный стрептоцид) в организме расщепляется с образованием сульфаниламида



Сульфаниламид (белый стрептоцид) похож по структуре на пара-аминобензойную кислоту (справа). Будучи ее антиметаболитом, он блокирует биосинтез жизненно необходимой фолиевой кислоты.



Фолиевая кислота в организме восстанавливается в активную форму - тетрагидрофолиевую кислоту. Этот процесс блокируется триметопримом (внизу).



Классификация сульфаниламидов

- 1) Хорошо всасываются, создавая в тканях высокие концентрации (стрептоцид, сульфатиозол, сульфадимезин, сульфаэтидол)
- 2) Хорошо всасываются и быстро выводятся из организма – высокие концентрации в моче (сульфатиозол, сульфакарбамид)
- 3) Медленно и неполно всасываются – оказывают влияние в кишечнике (фталилсульфатиозол, сульгин, дисульфформин)
- 4) Хорошо растворимые в воде и жидких средах организма (сулфацил, стрептоцид, сульциамид)

Классификация сульфаниламидов по продолжительности действия

- 1) Сульфаниламиды короткого действия 3 – 4 часа (стрептоцид, сульфатиозол, этазол, сульгин, фталилсульфатиозол)**
- 2) Сульфаниламиды средней продолжительности 8 – 12 часов (сульфаметоксазол)**
- 3) Длительного действия – до 24 часов (сульфапиридазин, сульфамонетоксин)**
- 4) Сверхдлительного действия 7-10 дней (сульфален, келфизин)**

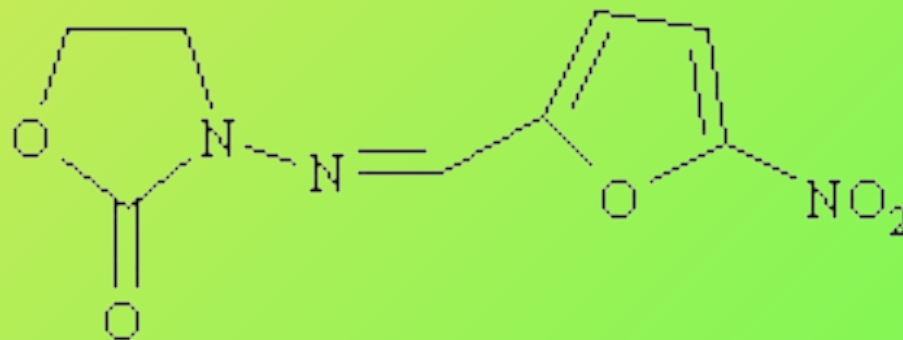
Побочные эффекты сульфаниламидов

- 1) Кристаллурия, поражение почек
(дизурия)**
- 2) ЖКТ – тошнота, рвота, понос**
- 3) Кроветворение – мет- и
сульфагемоглобинообразование,
тромбоцитопения, геморрагический
диатез**
- 4) Дефицит витаминов В и К
(угнетение сапрофитной флоры)**
- 5) Гипотиреоз**
- 6) Аллергические реакции**

Нитрофураны



Фурагин



Фуразолидон

Нитрофураны

- 1) Фурациллин
- 2) Диафурон
- 3) Нитрофурантоин
- 4) Фуральтадон
- 5) Фурагин
- 6) Солафур
- 7) Нифурател
- 8) Лифузоль

Фторхинолоны

Лекарственные вещества, широко применяющиеся в медицине, с принципиально новой химической структурой и механизмом действия, отличающимся от антибиотиков и сульфаниламидов.

Фторхинолоны

Ципрофлоксацин, офлоксацин, пефлоксацин, левофлоксацин, ломефлоксацин, моксифлоксацин, норфлоксацин.

Механизм действия: угнетение активности одного из ключевых ферментов микробной клетки – ДНК-гираз (топоизомераз II, IV), что приводит к нарушению синтеза ДНК.

Фторхинолоны

показания к назначению

- 1. Бактериальная инфекция кожи, мягких тканей, суставов**
- 2. Бактериальный эндокардит**
- 3. Вторичные бактериальные менингиты**
- 4. Шигеллез, сальмонеллез, брюшной тиф, легионеллез, холера, бактериальные энтериты**
- 5. Бруцеллез**
- 6. Иерсиниозы**
- 7. Лептоспироз**
- 8. Боррелиоз**
- 9. Бактериальный сепсис, инфекция у больных с нейтропенией, перитонит**
- 10. Бактериальная инфекция мочевыводящих путей, половых органов**
- 11. Хламидиоз, микоплазменная инфекция**
- 12. Гонорея, мягкий шанкр**
- 13. Бактериальная инфекция нижних дыхательных путей, в т.ч. у больных муковисцидозом**
- 14. Осложненные формы синуситов, злокачественный отит**
- 15. Туберкулез, лепра и другие микобактериозы**
- 16. Некоторые риккетсиозы**

Фторхинолоны

побочные эффекты

- 1. Анорексия, тошнота, рвота, расстройства вкуса**
- 2. Головная боль, головокружение**
- 3. Нарушение сна**
- 4. Судороги**
- 5. Удлинение интервала QT на ЭКГ (риск развития аритмии)**
- 6. Сыпь, крапивница**
- 7. Ангионевротический отек**
- 8. Фотосенсибилизация**
- 9. Полинейропатия**

Противопоказания:

- 1. Гиперчувствительность к фторхинолонам**
- 2. Беременность**
- 3. Кормление грудью**
- 4. Дети до 18 лет (фторхинолоны нарушают рост и развитие костной ткани)**

По рецепту

Офлоксацин (заноцин, таривид)

Спектр действия: грам – бактерии и многие возбудители, устойчивые к антибиотикам

При туберкулезе - таривид.

0,2 – 0,4 - 2 раза в день курсом в 10 дней, затем перерыв и следующий курс.



По рецепту

Ципрофлоксацин



Высокая активность в отношении стафилакокков, хламидий, микоплазмы, микобактерий туберкулеза, лептоспир. Особенно важен для стартовой терапии тяжелых септических состояний, эмпирической терапии, лечения синегнойной инфекции.

250 – 750 мг 1-2 раза в день per os или внутривенно.

К респираторным фторхинолонам относятся левофлоксацин, моксифлоксацин

Левофлоксацин

Показания: острый синусит, обострение хронического бронхита, внебольничная пневмония, осложненные и неосложненные инфекции мочевыводящих путей (включая пиелонефрит), простатит, инфекции кожи и мягких тканей, септицемия/бактериемия, интраабдоминальная инфекция.

Формы выпуска: таб. 0,25 и 0,5; раствор 0,5% во флаконах по 100 мл

Моксифлоксацин

Показания: острый синусит, обострение хронического бронхита, внебольничная пневмония (при резистентности микроорганизмов к антибиотикам), неосложненные воспалительные заболевания органов малого таза, инфекции кожи и мягких тканей, интраабдоминальные инфекции.

Формы выпуска: таб. 0,4