

МИНИСТЕРСТВО СЕЛЬСКОГО ХОЗЯЙСТВА
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
ФГБОУ ВПО КОСТРОМСКАЯ
ГОСУДАРСТВЕННАЯ
СЕЛЬСКОХОЗЯЙСТВЕННАЯ АКАДЕМИЯ

Кафедра «Эпизоотология, микробиология и
вирусология»

Презентация по теме «Антибиотики»

Выполнила
студентка 4 курса 2 группы
Зайцева Д.С.

ЦЕФАЛОСПОРИНЫ

Цефалоспорины (англ. cephalosporins) — это класс β -лактамных антибиотиков, в основе химической структуры которых лежит 7-аминоцефалоспоровановая кислота (7-АЦК)

Основная особенность

- ✓ большая резистентность по отношению к β -лактамазам — ферментам, вырабатываемым микроорганизмами.

Цефалоспорины проявляют бактерицидное действие.

Механизм действия:

- повреждение клеточной мембраны бактерий
- высвобождение аутолитических ферментов, что приводит к их гибели.

История открытия

Цефалоспорины были впервые выделены из культур *Cephalosporium acremonium* в 1948 году итальянским ученым Джузеппе Бротзу который заметил, что культуры продуцировали вещества, эффективно уничтожавшие *Salmonella typhi*, возбудителя тифа, которая имела активный фермент бета-лактамазу.

С 1955 по 1962 г. детально изучались культуры *C. acremonium* рабочими группами Н. Florey и Е. Р. Abraham.

Из продуктов обмена веществ этого гриба удалось выделить бактерицидную субстанцию - цефалоспорин С, ставшую исходным веществом для получения 7-аминоцефалоспоровановой кислоты - структурной основы цефалоспоринов.

В 1962 г. в клиническую
практику был введен первый
антибиотик класса
цефалоспоринов - *цефалоридин*

Классификация

I поколение	II поколение	III поколение	IV поколени е	V поколени е
цефалорид ин цефалотин цефапирин цефрадин цефазолин цефалексин цефадрокс л	цефуроксим цефаклор цефамандол цефотиам цефсулодин цефокситин	цефотаксим цефоперазон цефтриаксон цефтибутен цефтазидим цефиксим цефподоксим цефодизим цефетамет	цефпиром цефепим	цефтобипр ол

Сравнительная характеристика антимикробной активности

Поколение антибиотика	Чувствительность микроорганизмов	
	Гр +	Гр -
I	++++	+
II	+++	++
III	+	+++
IV	++	++++

Фармакокинетика

- ✓ Из желудочно-кишечного тракта всасывается только цефалексин (90 % принятой дозы)
- ✓ Остальные цефалоспорины сильно раздражают слизистые оболочки
- ✓ В/м: максимальная концентрация в плазме крови через 30...60 мин, у грудных детей — через 30 мин, иногда раньше.
- ✓ Цефалоспорины 1-го и 2-го поколений мало проникают через гематоэнцефалический барьер.

- ✓ Элиминируют в основном через почки
- ✓ При повторном введении возможна их кумуляция, что приводит к увеличению концентрации препарата в плазме крови и в тканях и повышению его токсичности
- ✓ Период полувыведения большинства цефалоспоринов колеблется в пределах 1-2 ч.

Показания

Основным показанием для применения цефазолина в настоящее время является периперационная профилактика в хирургии. Он используется также для лечения инфекций кожи и мягких тканей.



✓ Бактериальные
инфекции верхних
и нижних
дыхательных путей,
уха, горла и носа,
мочевыводящих
путей, костей и
суставов, органов
малого и брюшной
полости, желчных
путей и ЖКТ,
сепсис,
бактериальная
септицемия,
перитонит,
менингит



Инфекции нижних отделов дыхательных и мочевыводящих путей; почек; инфекциях уха, носа, горла (за исключением энтерококковых); при септицемии; эндокардите; инфекциях костей и мягких тканей, брюшной полости; при гинекологических инфекционных заболеваниях
бактериальный менингит



Сидоренко С.В., Козлов С.Н. Практическое
руководство по антиинфекционной химиотерапии:
Группа цефалоспоринов. НИИАХ СГМА
<http://www.antibiotic.ru/ab/023-29.shtml>

<http://pulmonolog.com/drugs/tsefalosporiny>

А.И.Синопальников, О.В.Фесенко (Каф. терапии
Военно-медицинского
факультета при Российской медицинской
академии последипломного образования,
Москва).

<http://works.tarefer.ru/51/100321/index.html>

МАКРОЛИДЫ

- ⦿ <http://ru.wikipedia.org/wiki/Макролиды>
- ⦿ Л.С. Страчунский, С.Н. Козлов.
Руководство для врачей
<http://www.antibiotic.ru/books/mach/mac0111.shtml>

Макролиды — группа лекарственных средств, большей частью антибиотиков, основой химической структуры которых является макроциклическое 14- или 16-членное лактонное кольцо, к которому присоединены один или несколько углеводных остатков. Макролиды относятся к классу поликетидов, соединениям естественного происхождения.

Также к макролидам относят:

- ✓ аzaлиды, представляющие собой 15-членную макроциклическую структуру, получаемую путем включения атома азота в 14-членное лактонное кольцо между 9 и 10 атомами углерода;
- ✓ кетолиды — 14-членные макролиды, у которых к лактонному кольцу при 3 атоме углерода присоединена кетогруппа.

✓ Первый из макролидов — эритромицин — был получен в 1952 году из почвенного актиномицета *Streptomyces erythreus* и использовался для лечения инфекций, вызванных грамположительными бактериями как альтернативный препарат у пациентов с аллергией на пенициллины.

✓ Расширение сферы применения макролидов произошло в 70 — 80-х

14-членные	15-членные (азалиды)	16-членные
Природные		
эритромицин олеандомицин		мидекамицин спирамицин лейкомицин джозамицин
Пролекарства		
эфирь эритромицина соли эритромицина соли эфиров эритромицина соли олеандомицина эфирь олеандомицина		соли мидекамицина
Полусинтетические		

Общие свойства

- ✓ Преимущественно бактериостатическое действие.
- ✓ Активность против грамположительных кокков (стрептококки, стафилококки) и внутриклеточных возбудителей (микоплазмы, хламидии, легионеллы).
- ✓ Высокие концентрации в тканях (в 5-10-100 раз выше плазменных).

- ✓ Низкая токсичность.
- ✓ Отсутствие перекрестной аллергии с β -лактамами.
- ✓ У 14-членных макролидов взаимодействие с теофиллином, карбамазепином, циклоспорином, цизапридом и др.

ЭРИТРОМИЦИН

- ✓ Первый природный макролид. Один из самых безопасных антибиотиков.



Фармакокинетика

- ✓ Всасывается в ЖКТ не полностью.
- ✓ Биодоступность варьирует от 30 до 65%, причем значительно снижается в присутствии пищи.
- ✓ Хорошо проникает в бронхиальный секрет, желчь.
- ✓ Плохо проходит через ГЭБ, ГОБ.
- ✓ Выводится преимущественно через

Показания

- ✓ Стрептококковые инфекции (БГСА)
- ✓ Внебольничная пневмония.
- ✓ Дифтерия.
- ✓ Коклюш.
- ✓ Ородентальные инфекции
- ✓ Кампилобактериоз
- ✓ Инфекции кожи и мягких тканей.

РОКСИТРОМИЦИН

Полусинтетический 14-членный макролид. По спектру активности близок к эритромицину.



Отличия от эритромицина:

- ✓ более стабильная биодоступность (50%), практически не зависящая от пищи;
- ✓ более высокие концентрации в крови и тканях;
- ✓ более длительный $T_{1/2}$ - 10-12 ч; лучшая переносимость; менее вероятны лекарственные взаимодействия.

КЛАРИТРОМИЦИН

Отличия от
эритромицина:



- ✓ повышена активность против *H.influenzae*;
- ✓ самый активный из всех макролидов в отношении *H.pylori*;

- ✓ действует на атипичные микобактерии (*M. avium* и др.), вызывающие оппортунистические инфекции при СПИДе;
- ✓ большая кислотоустойчивость и биодоступность (50-55%), не зависящая от еды;
- ✓ более высокие концентрации в тканях;
- ✓ более длительный $T_{1/2}$ (3-7 ч);
- ✓ лучшая переносимость;

НИТРОФУРАНЫ

- ⦿ <http://slovari.yandex.ru/нитрофураны/БСЭ/Нитрофураны/>

Нитрофураны -
производные фурана, в
котором атом водорода
замещен нитрогруппой.

- ✓обладают широким
спектром антимикробного
действия
- ✓тормозят дыхание
микробной клетки.

- ✓ В хирургии нитрофураны применяют при лечении ран и для профилактики послеоперационных осложнений (фурацилин);
- ✓ в акушерстве, гинекологии и урологии — при лечении инфекционных заболеваний (фурадонин, фуразолидон);
- ✓ применяют также для лечения лямблиоза и трихомоноза

Механизм действия

- ✓ нарушают процесс клеточного дыхания бактерий
- ✓ ингибируют биосинтез нуклеиновых кислот.
- ✓ В зависимости от концентрации оказывают бактериостатический или бактерицидный эффект.
- ✓ К нитрофуранам редко развивается лекарственная резистентность микроорганизмов.

Фармакокинетика

- ✓ Внутрь: хорошо и быстро всасываются.
- ✓ Быстро выводятся из организма (период полувыведения в пределах 1 ч).
- ✓ Нитрофурантоин и фуразидин накапливаются в моче в высоких концентрациях, фуразолидон - только в количестве 5% принятой дозы (поскольку в значительной степени метаболизируется)

✓ Частично экскретируются с желчью и создают высокие концентрации в просвете кишечника.

✓ При почечной недостаточности выведение нитрофуранов значительно замедляется.

Показания

- ✓ Инфекции нижних отделов МВП: острый цистит, супрессивная терапия хронических инфекций (нитрофурантоин, фуразидин).
- ✓ Профилактика инфекционных осложнений при урологических операциях, цистоскопии, катетеризации мочевого пузыря (нитрофурантоин, фуразидин).

- ✓ Кишечные инфекции: острая инфекционная диарея, энтероколит (нифуроксазид, нифурател).
- ✓ Лямблиоз (фуразолидон, нифурател).
- ✓ Трихомониаз (нифурател, фуразолидон).
- ✓ Местно - промывание ран и полостей (фуразидин).

Фуразолидон

- ✓ Более активен в отношении энтеробактерий и некоторых простейших.
- ✓ Низкие концентрации в моче.
- ✓ Применяется при лямблиозе.
- ✓ Вызывает дисульфирамоподобную реакцию



Фуразидин

- ✓ Препарат второго ряда для лечения острого цистита.
- ✓ Местно - для промывания ран и полостей

