

ГОСУДАРСТВЕННОЕ БЮДЖЕТНОЕ ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ УЧРЕЖДЕНИЕ  
ВЫСШЕГО ПРОФЕССИОНАЛЬНОГО ОБРАЗОВАНИЯ  
«КРАСНОЯРСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ МЕДИЦИНСКИЙ УНИВЕРСИТЕТ»  
ИМ. ПРОФ. В.Ф. ВОЙНО-ЯСЕНЕЦКОГО  
МИНИСТЕРСТВА ЗДРАВООХРАНЕНИЯ  
РОССИИ  
ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЙ КОЛЛЕДЖ

# Тема «Антибиотики»

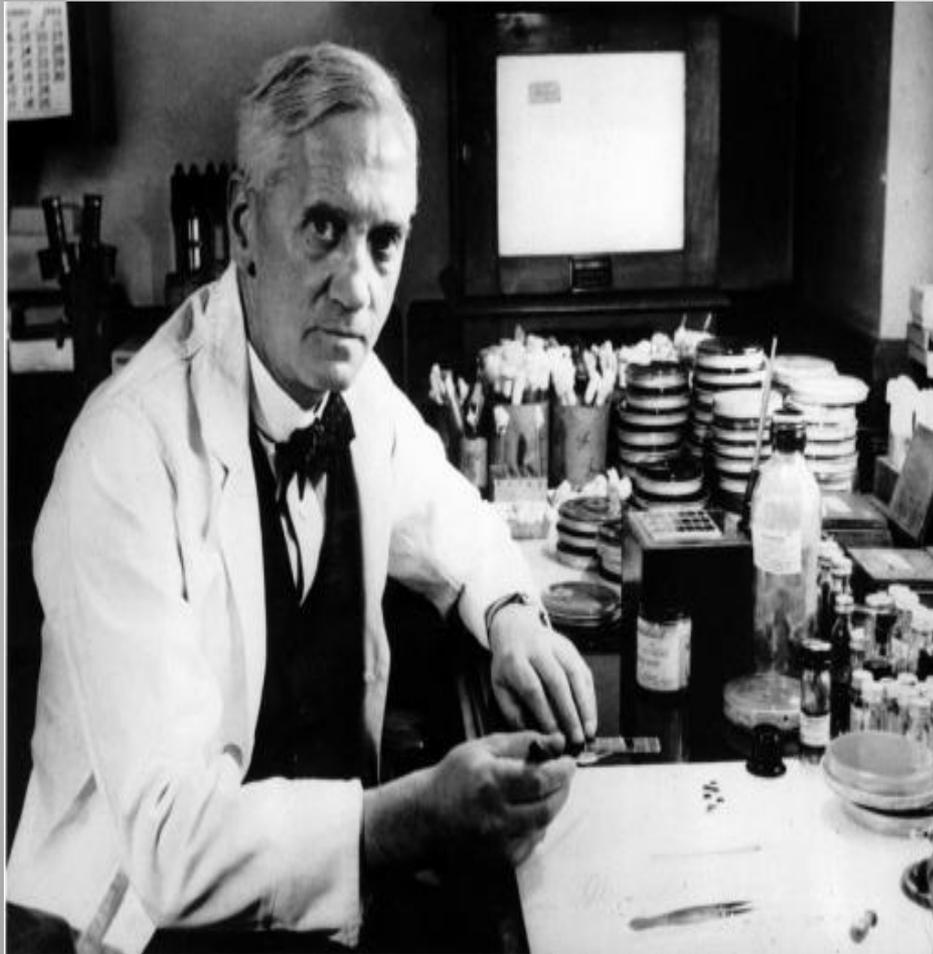
## Лекции №7,8

Преподаватель  
к.м.н. Потупчик Татьяна Витальевна  
2016

# План лекции

- 1) История открытия антибиотиков
- 2) Определение антибиотиков
- 3) Пенициллины
- 4) Классификация пенициллинов
- 5) Пенициллины узкого спектра действия
- 6) Защищенные пенициллины
- 7) Показания к применению
- 8) Побочные действия

# Антибиотики



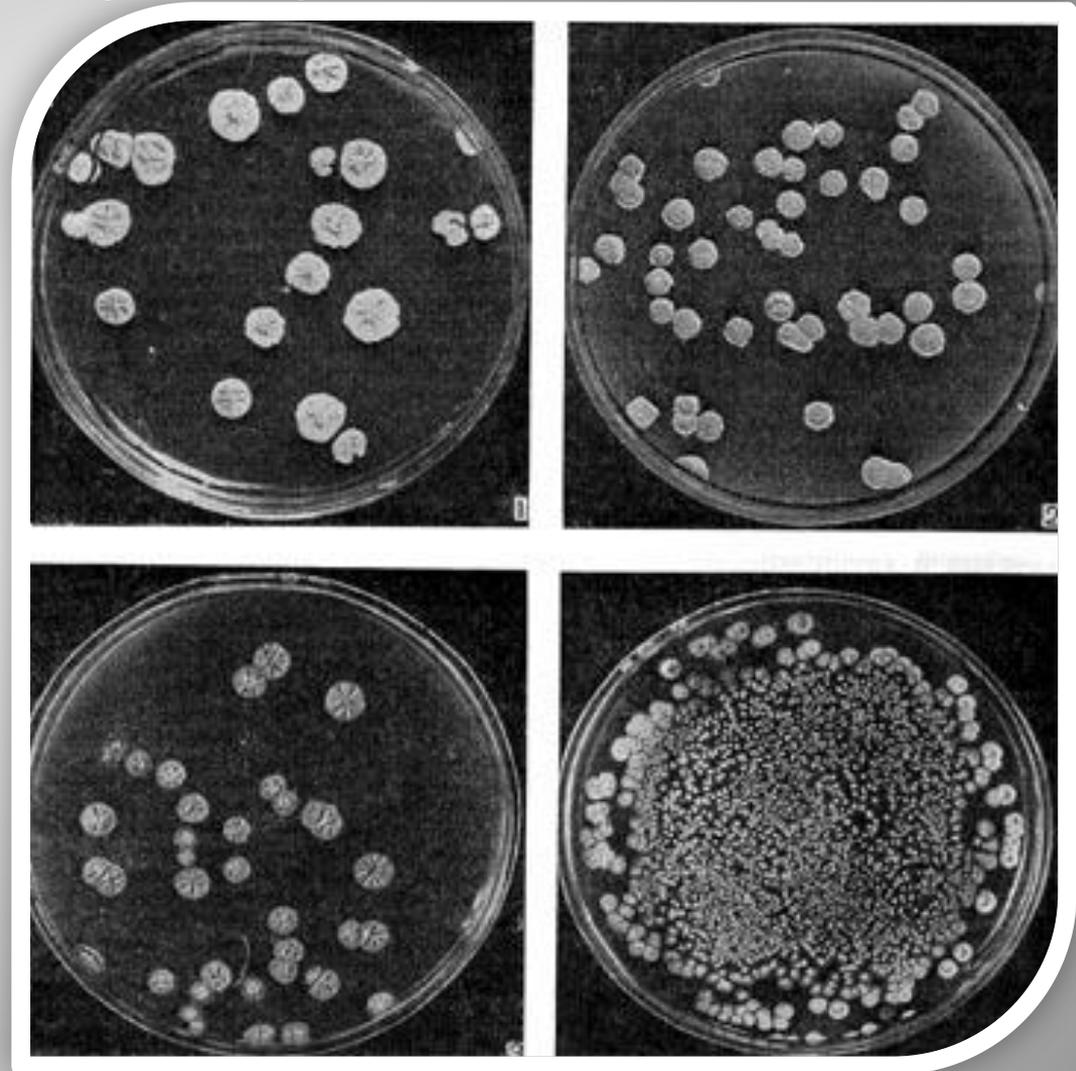
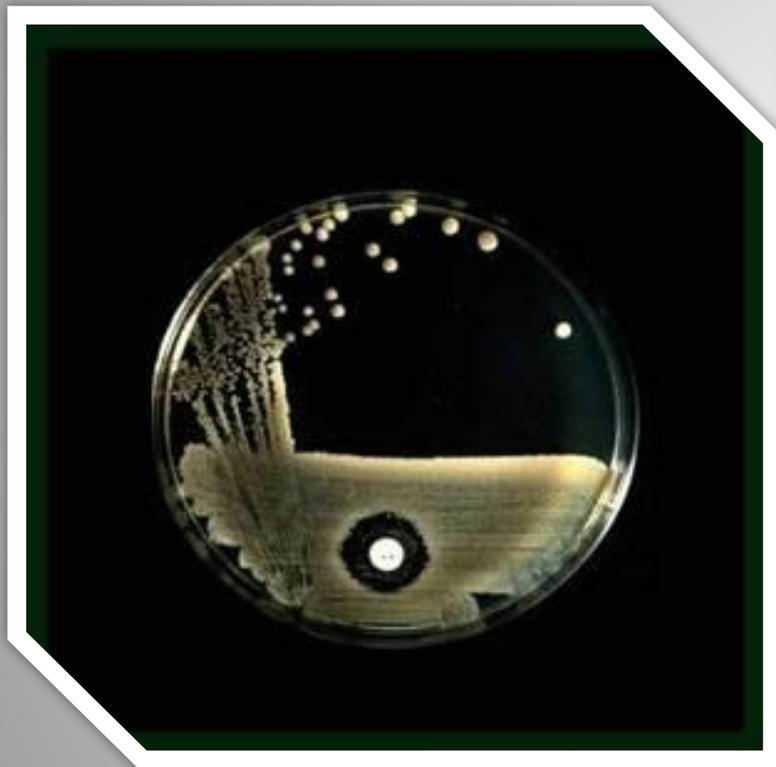
В 1929 г. случайность позволила английскому бактериологу **Александр Флемингу** впервые наблюдать противомикробную активность пенициллина.

**Антибиотики – это вещества  
микробного происхождения, их  
полусинтетические и  
синтетические аналоги,  
способные подавлять  
жизнеспособность  
чувствительных к ним  
микроорганизмов**

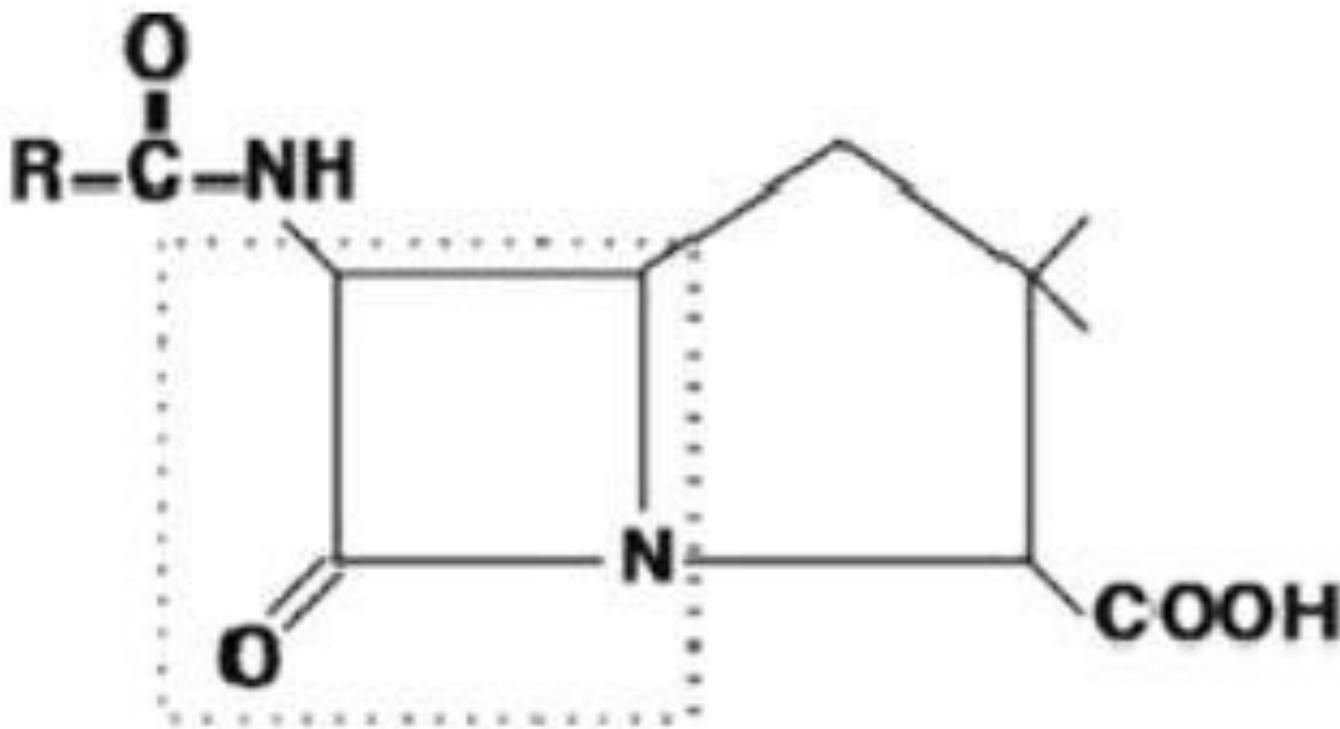
# Пенициллины



Пенициллины— группа антибиотиков, получаемая из многих видов плесневых грибов рода *Penicillium*.



Пенициллины относятся к бета-лактамам антибиотикам, так как имеют в своём строении бета-лактамное кольцо.



# Классификация пенициллинов

А) короткого действия: **Бензилпенициллина натриевая и калиевая соль**

**Феноксиметилпенициллин** (для приема внутрь);

Аминопенициллины: **ампициллин, амоксициллин;**

Уреидопенициллины: **пиперациллин, тикарциллин;**

Противостафилококковые пенициллины: **оксациллин, флоксациллин.**

Б) пролонгированные (дюранные):

**бензилпенициллина новокаиновая соль, бициллин – 1,3,5.**

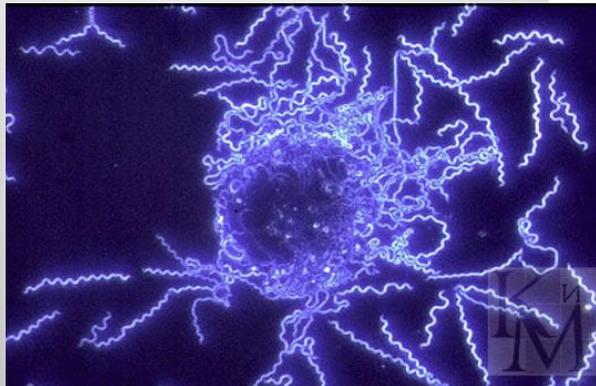
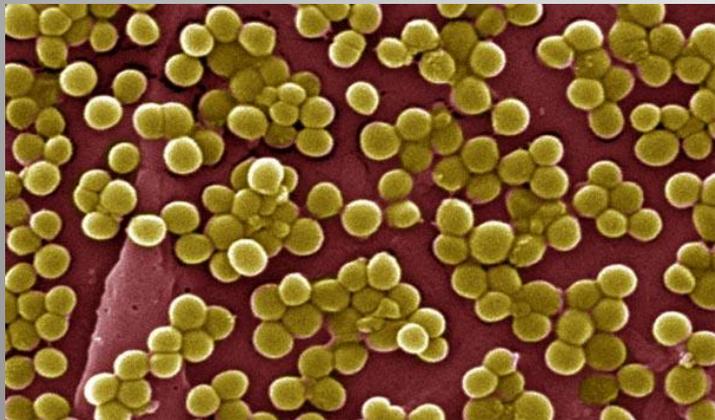
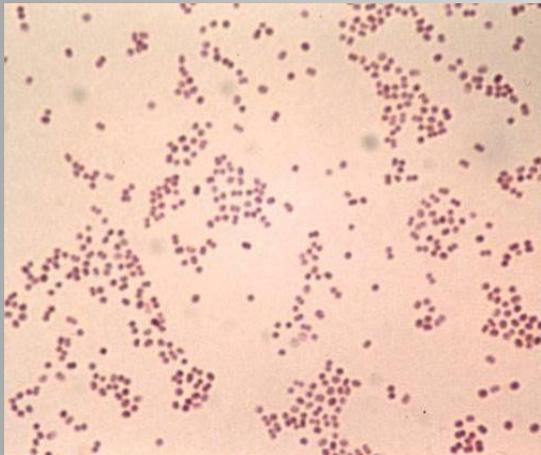
# Пенициллины



# Спектр действия

## пенициллинов

Пенициллины действуют на грамположительные (стафилококки, стрептококки) и грамотрицательные бактерии (пневмококки, гонококки, менингококки, спирохеты), палочку сибирской язвы, столбняка, коринебактерии дифтерии.



Микробы выделяют **бета-лактамазы**, которые разрушают антибиотики.

Для защиты антибиотика учеными выделено три **ингибитора бета-лактамаз**:

- клавулановая кислота
- сульбактам
- тазобактам.

Они необратимо связывают бета-лактамазы и не позволяют им разрушить антибиотик.

# Защищенные пенициллины

- Амоксиклав, Аугментин, Курам  
(амоксициллин/клавуланат)
- Амписид, Сультасим,  
Уназин(ампициллин/сульбактам),
- Зоперцин  
(пиперациллин/тазобактам)
- Тиментин  
(тикарциллин/клавуланат).



# Показания к применению пенициллинов

инфекции вызванные вышеперечисленными  
микроорганизмами:

- Тонзиллит, ангина;
- Скарлатина;
- Рожь;
- Профилактика ревматизма;
- Дифтерия
- Внебольничная пневмония;
- Менингит;
- Сепсис;
- Менингококковые инфекции (менингит, менингококцемия).
- Сифилис, гонорея.
- Столбняк
- Сибирская язва

Скарлатина



Бензилпенициллина натриевая и калиевая соль назначается только в/м или в/в 6 раз в сутки, бензилпенициллина новокаиновая соль только в/м 1-2 раза в сутки,

Бициллин – 1 только в/м 1 раз в 2 недели,

Бициллин – 3 только в/м 1 раз в 3 дня,

Бициллин – 5 только в/м 1 раз в месяц,

Феноксиметилпенициллин только для приема внутрь, 4-6 раз в сутки.

Ампициллин назначают внутрь в виде таблеток, капсул, суспензии и в/м или в/в 4-6 раз в сутки,

Оксациллин назначают внутрь в виде таблеток и в/м 4-6 раз в сутки, Амоксициллин («флемоксин солютаб», «амосин», «хинкоцил») назначают внутрь 2-3 раза в день.

Защищенные пенициллины назначают внутрь в виде табл., капсул, суспензии и в/м или в/в 1-2 раз в сутки.

# Побочные действия пенициллинов

1. Аллергические реакции.
2. Возникновение болезненности на месте введения, при внутримышечном введении, поэтому препараты лучше разводить в растворе новокаина.
3. Флебиты возможны при внутривенном введении.
4. Диспепсические расстройства при приеме внутрь.



# Цефалоспорины

это **бета-лактамы** антибиотики, получены из грибов вида *Cephalosporium*.

Механизм действия: нарушают синтез микробной стенки в момент митоза (роста и размножения).



## *Цефалоспорины I поколения*

*1. Для парентерального введения —*

**цефалоридин (цепорин)**

**цефазолин (кефзол)**

*2. Для приема внутрь –*

**цефалексин (кефлекс)**

**Их вводят 6 раз в сутки.**



**Спектр действия** грамположительные бактерии  
(стафилококки).

## *Цефалоспорины II поколения*

*1. Дня парентерального введения —*

**цефуроксим (цефурабол)**

**цефокситин (мефоксин)**

*2. Для приема внутрь —*

**цефуроксим (зиннат)**

**цефаклор (цеклор)**

**Их вводят 3 раза в сутки.**



**Спектр действия: грамотрицательная флора.**

## *Цефалоспорины III поколения*

1. *Для парентерального введения* —  
**цефотаксим (клафоран),  
цефтазидим (фортум),  
цефтриаксон (цефтриабол).**



2. *Для приема внутрь* —  
**цефиксим (супракс).**



Их вводят **1-2 раза** в сутки.

**Спектр действия:** шире, чем у I и II поколений,  
более выражен в сторону грамотрицательной флоры.

## *Цефалоспорины 4 поколения*

Все препараты вводят только парентерально (в/м или в/в).

**цефпиром (кейтен)**

**цефепим (максицеф)**

Их вводят **2-3** раза в сутки.



**Спектр действия: очень широкий,  
одинаково высоко активны относительно и  
грамотрицательной и грамположительной  
флоры.**

# Показания к применению

1. Инфекции *дыхательных путей* (пневмоний, плевритов, абсцессов легких),
2. *Бактериальный менингит*, вызываемый менингококками, пневмококками, гемофильными палочками, стрептококками  
Препараты выбора — цефалоспорины III поколения, т.к. лучше других проникающие через гематоэнцефалический барьер.
3. *Интенсивная терапия новорожденных.*
4. *Инфекционные заболевания костей, суставов, кожи и мягких тканей* (III и IV поколения).
5. *Инфекция почек и мочевыделительных путей, вызываемая:* кишечными палочками, клебсиеллами, протеем, стрептококками (Цефалоспорины II и III поколений).
6. *Лечение тяжелых госпитальных инфекций* различной локализации, септицемии и лихорадки неясного генеза у больных (цефалоспорины 4 поколения).

## Побочные действия

### 1. *Аллергические реакции.*

2. *Возникновение болезненности на месте введения*, при внутримышечном введении, поэтому препараты лучше разводить в растворе новокаина; *флебиты* возможны при внутривенном введении, следовательно, вводить препараты надо медленно, лучше капельно.

3. *Диспепсические расстройства и дисбактериоз* при приеме через рот.

4. *Нефротоксичность* — возникает в основном при использовании цефалоспоринов I поколения, которые экскретируются с помощью канальцевой секреции.

5. *Нейротоксичность* (нистагм, нарушение поведения, галлюцинации, судороги).

6. *Гематоксичность* (тромбоцитопения, нейтропения, коагулопатии).

7. *Гепатотоксичность* — повышение печеночных трансаминаз.

8. *Антабусоподобное действие* (снижается активность дегидрогеназы ацетальдегида - фермента, метаболизирующего алкоголь). На фоне приема цефалоспоринов опасно употребление спиртных напитков — могут появиться диарея, тошнота, тахикардия, покраснение лица и пр.

# Монобактамы

## Азтреонам (азтреабол)

В своей структуре имеют моноциклическое бета-лактамное кольцо.

**Спектр действия:** грамотрицательных бактерий (кишечная и синегнойная палочки, протей, клебсиелла). Обладают высокой устойчивостью к бета-лактамазам, вырабатываемым грамотрицательными бактериями.

**Применяют** при тяжелых инфекциях мочевыводящих путей, брюшной полости, малого таза, менингите, пневмонии, сепсисе и т.д.

Вводят в/м или в/в 2-3 раза в сутки.

Хорошо переносится. Осторожно применять у больных с аллергией на бета-лактамные антибиотики.



# Карбопенемы

**Имипенем (меропенем, меронем)**

**Тиенам (имипенем + циластатин)**

**Гримипинем (имипенем + циластатин)**



**Спектр действия** широкий: грамм (-) и грамм (+) аэробные и анаэробные бактерии, включая синегнойную палочку. Устойчивы к бета-лактамазам.

**Тиенам (имипенем + циластатин).** Циластатин – вещество, которое предупреждает разрушение имипенема ферментом дегидропептидазой в почках.

**Применяют** при тяжелых инфекциях в случае устойчивости к другим антибиотикам.

Вводят в/м или в/в, дозы и схемы индивидуально.

**Побочные эффекты:** диспепсические расстройства, изменение крови, аллергические реакции, местно - болезненность, покраснение, флебиты.

**Противопоказания:** при аллергии на бета-лактамные антибиотики.

# Макролиды

1 поколения:

Эритромицин;

2 поколения:

Спирамицин (ровамицин),  
Рокситромицин (рулид),  
Кларитромицин (клацид),  
Мидекамицин (макропен),  
Джозамицин (вильпрофен);

3 поколения

Азитромицин (сумамед).



# Макролиды 1 поколения



# Макролиды 2 поколения

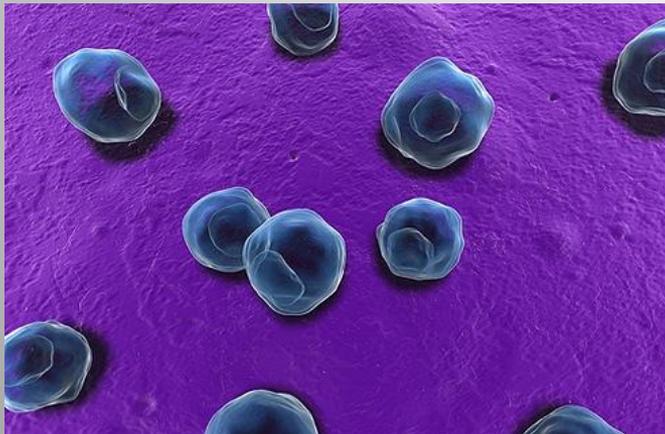


# Макролиды 3 поколения (Азалиды)



# Спектр действия макролидов

- внутриклеточные микроорганизмы - хламидии и микоплазмы,
- грамположительные кокки (стафилококки, стрептококки, пневмококки),
- грамположительные палочки (коринебактерии),
- грамотрицательные коккобактерии (бордетеллы),
- грамотрицательные палочки (моракселлы).



# Показания к применению

1. Нетяжелые формы бронхитов, тонзиллитов, отитов, синуситов; стрептодермия, рожа, лимфангит, мастит.
2. Коклюш и дифтерия.
3. Хламидиоз и микоплазмоз.
5. Первичный сифилис и гонорея.
6. Холециститы, холангиты, энтериты, колиты.
7. Токсоплазмоз (препарат выбора спирамицин).



Рожа



# Побочные действия

1. Диспепсические явления (тошнота, рвота, диарея).
2. Стоматиты, гингивиты.
3. Холестаз.
4. При внутривенном введении — флебит.



# АМИНОГЛИКОЗИДЫ

Первый представитель этой группы **стрептомицин** был внедрен в 1944 г. английским микробиологом А. Шатцом и рассматривался как одно из наиболее эффективных лекарственных средств для лечения инфекций, вызванных грамотрицательными микроорганизмами.



Выделяют 4 поколения  
аминогликозидных антибиотиков:

**1 поколение:**

Стрептомицин

Неомицин

Канамицин

Мономицин



**2 поколение: Гентамицин (гарамицин)**



### *3 поколение:*

Тобрамицин (бруламицин)

Сизомицин

Амикацин (амикин)

Нетилмицин (нетиллин)



### *4 поколение: Изепамицин (исепацин)*

**Механизм действия:** Нарушают структуру и функцию цитоплазматической мембраны и синтез РНК на уровне рибосом.

**Спектр действия** — *широкий*. Они влияют на грамотрицательные палочки (эшерихии, клебсиеллы, сальмонеллы, шигеллы, протей, гемофильные палочки), грамположительные кокки (золотистые стафилококки), грамотрицательные коккобактерии франциселлы (возбудители туляремии), микобактерии туберкулеза, дизентерийные амебы, лейшмании и трихомонады.

# Показания к применению

1. **Осложненные инфекции мочевыделительной системы**  
(острый пиелонефрит, паранефрит, уросепсис)

2. **Осложненные интраабдоминальные инфекции**  
(перитонит, абсцесс в брюшной

3. **Осложненные инфекции полости) респираторного тракта**  
(плевропневмонии)

4. **Остеомиелит**

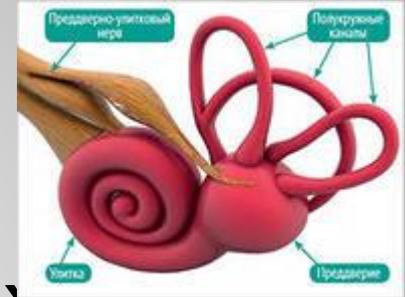
5. **Менингиты.**

6. **Санация кишечника** при подготовке больного к операции на органах брюшной полости и для лечения кишечных инфекций

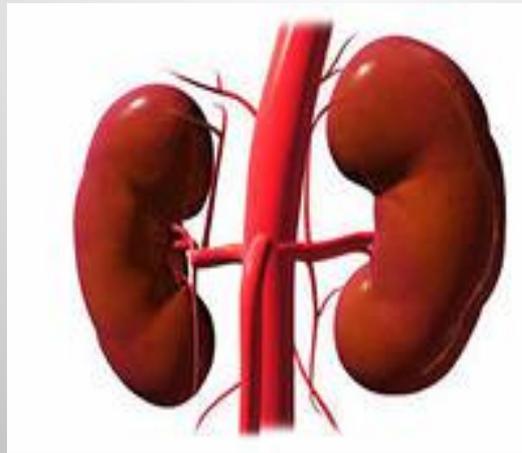
# Побочные действия

## 1. Ототоксичность (10-25%).

Накапливаются в наружных и внутренних волосковых клетках кортиевого органа, приводя к их дегенеративным изменениям во внутреннем ухе, это приводит к необратимой глухоте; вызывают вестибулярные расстройства.



2. Нефротоксичность (8-26%)  
накапливаются в  
эпителиальных клетках  
проксимальных канальцев  
почек



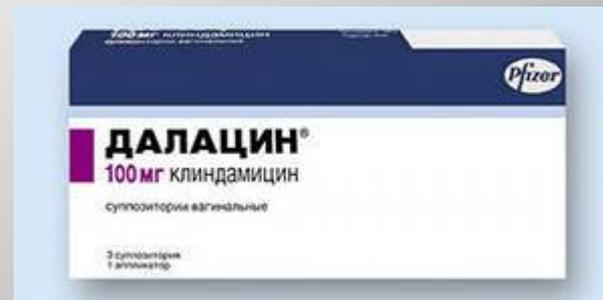
# 7. Линкозамиды

## Линкомицин

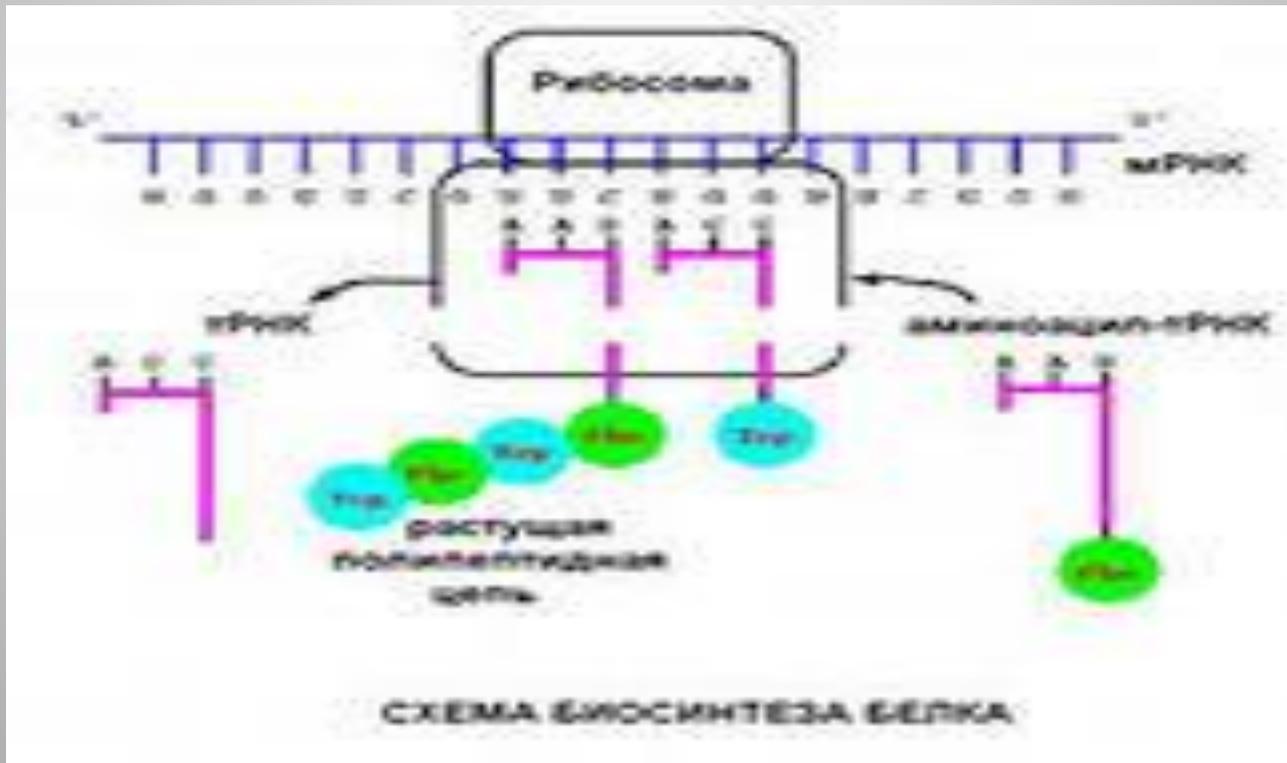
Клиндамицин (Далацин С)

**Спектр действия – широкий**

Грам +, грам -, анаэробы  
(бактероиды)



# Механизм действия: Ингибируют синтез РНК на уровне рибосом микробной клетки



# Показания к применению:

1. Сепсис, остеомиелит
  2. Интраабдоминальная инфекция (осложнения после операций в брюшной полости и органах малого таза)
  3. Инфекции дыхательных путей (пневмонии эмпиема плевры)
  4. Раневая инфекция кожи и мягких тканей
  5. Токсоплазмоз, малярия (клиндамицин)
- Применяют 3 (4) раза в день внутрь в капсулах, в.м. или в.в.

# Побочные действия

1. Диспепсические расстройства
2. Аллергические реакции



# Тетрациклины

**Спектр действия** – очень широкий: грам+ и грам- кокки, шигеллы, брюшнотифозная палочка, спирохеты, возбудители особоопасных инфекций (чумы, холеры, туляремии, бруцеллеза), риккетсии, хламидии, амебы. Доксициклин влияет на геликобактер пилори.

## 1. Природные тетрациклины: тетрациклин

## 2. Полусинтетические тетрациклины:

**доксициклин (вибрамицин, юнидокс)  
метациклин (рондомицин)**



# Показания к применению тетрациклинов

Сыпной тиф, газовая гангрена, дизентерия, чума, холера, бруцеллез, туляремия, хламидиоз, трахома, сибирская язва.

Реже в последнее время назначают при: пневмонии, бронхитах, остеомиелите, инфицированных ожогах и ранах, сифилисе, гонорее.

Назначают тетрациклин обычно внутрь 4 раза в день, пролонгированные – 2 раза в день, местно в виде глазной мази - тетрациклин, внутривенно –



холера



Газовая гангрена

# Побочные действия тетрациклинов

Тетрациклины - **токсичные препараты.**

1. Повреждение быстроделющихся клеток: угнетение кроветворения (миелотоксичность), нарушение сперматогенеза, а также деления клеток ЖКТ (стоматит, эрозии, язвы).

2. Гепатотоксичность и нефротоксичность.

3. Нарушение развития костей и зубов у детей



# Гликопептиды

**Ванкомицин (ванкомабол)** - природный гликопептидный антибиотик.

**Механизм действия:** подавляет синтез микробной стенки и нарушает функцию клеточной мембраны бактерий, оказывает сильное бактерицидное действие.

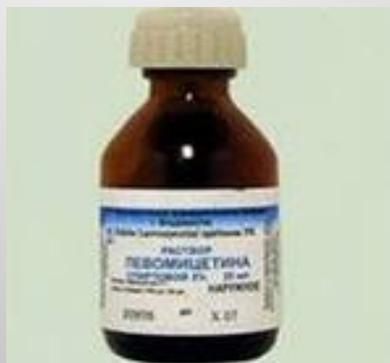
**Спектр действия:** различные виды стафилококков, стрептококки, листерии, грамм (+) анаэробы.

**Показания к применению (а/б резерва):** при тяжелых инфекциях: менингите, пневмонии, сепсисе, эндокардите, остеомиелите.

**Вводят в/в капельно 3-4 раза в сутки,** возможны тромбофлебиты. Применяется внутрь при псевдомембранозном колите, т.к. не всасывается в ЖКТ.

**Побочные действия:** нефро и ототоксичны. При быстром введении (выброс гистамина) – снижение АД, расширение сосудов кожи, красная сыпь (синдром «красного человека»), поэтому предварительно вводят антигистаминные средства (супрастин, тавегил).

# Левомицетины



# Спектр действия

— очень широкий: грамположительные (гемофильная палочка, пневмококки, менингококки) и грамотрицательные микробы (шигеллы, сальмонеллы, брюшнотифозная палочка), грамположительные анаэробы, риккетсии, хламидии, микоплазмы.

# Показания к применению

Левомицетин следует назначать только при тяжелых инфекциях:

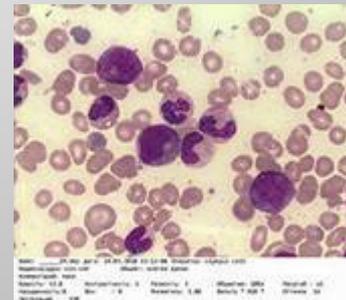
1. Менингит, тяжелая пневмония, вызванная гемофильной палочкой.
2. Брюшной тиф, дизентерия, сальмонеллез.
3. Внутриглазная инфекция.
4. Бруцеллез, туляремия.

Левомицетин назначают внутрь, внутривенно, внутримышечно или в форме аэрозоля в легкие, ректально, в виде глазных капель, наружно в виде мази линимента. Кратность – 4 раза в сутки.

# Побочный действия

Левомицетин — токсичный препарат (запрещен в ряде стран)

1. Миелотоксическое действие.
2. Аллергические реакции.
3. Диспепсические расстройства.
4. Дисбактериоз.



# Рекомендуемая литература:

- **Основная литература**

1. Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой: учеб.пособие / В. А. Астафьев. – М. :Кнорус, 2013. – 544с.

- **Дополнительная литература**

1. Харкевич, Д. А. Фармакология с общей рецептурой [Электронный ресурс] : учебник / Д.А. Харкевич. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2013. - 464 с. Режим доступа: <http://www.medcollelib.ru/book/ISBN9785970427002.html>.
2. Майский, В. В. [Фармакология с общей рецептурой](#) [Электронный ресурс] : учеб.пособие / В. В. Майский, Р. Н. Аляутдин. - 3-е изд., доп. и перераб. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2014. - 240 с. : ил. – Режим доступа :<http://www.medcollelib.ru/book/ISBN9785970429600.htm>.
3. Аляутдин, Р. Н. Фармакология [ Электронный ресурс ] : рук.кпракт. занятиям : учеб. пособие / Р. Н. Аляутдин, Н. Г. Преферанский, Н. Г. Преферанская; под ред. Р.Н. Аляутдина. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2010. - 608 с. – Режим доступа : <http://www.medcollelib.ru/book/ISBN9785970416747.html>.
4. Фармакология [Электронный ресурс]: учебник / под ред. Р.Н. Аляутдина. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2013. – 832с. - Режим доступа:  
<http://www.medcollelib.ru/book/ISBN9785970425183.html>.

- **Электронные ресурсы**

1. ЭБС КрасГМУColibris;
2. ЭБС Консультант студента
3. ЭБС ibooks;
4. НЭБ elibrary.

Спасибо за внимание!

