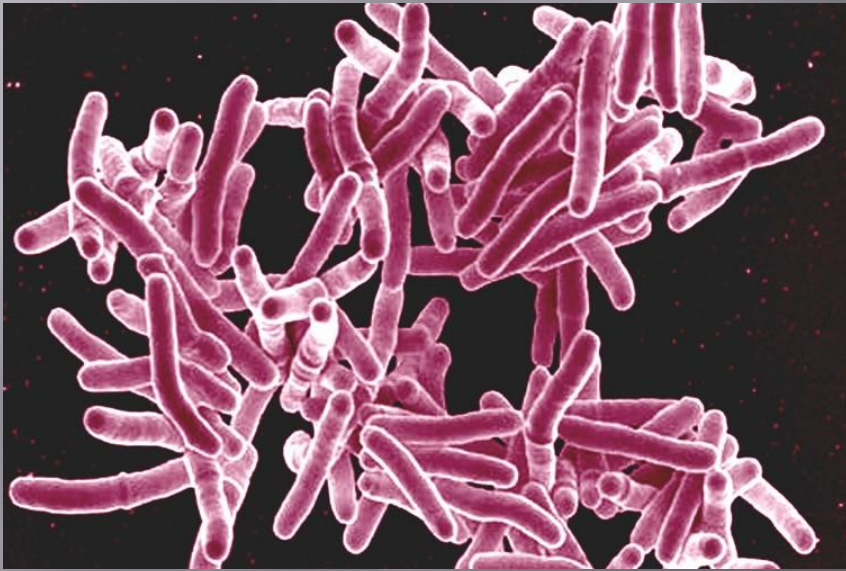


ПРОТИВОТУБЕРКУЛЕЗНЫЕ, ПРОТИВОСПИРОХЕТОЗНЫЕ СРЕДСТВА

Кафедра фармакологии

Противотуберкулезные средства

Противотуберкулёзные препараты — препараты активные по отношению к палочке Ко́ха



Противотуберкулезные средства

- Большинство противотуберкулезных препаратов оказывают бактериостатическое, а не бактерицидное действие. Препараты не оказывают воздействия на туберкулезные микобактерии, находящиеся в инкапсулированных очагах казеоза и кавернах с выраженной фиброзной стенкой, так как казеоз и фиброзная ткань лишены кровеносных сосудов, по которым препараты могли бы проникнуть в очаги поражения.

ОБЩИЕ ПРИНЦИПЫ ХИМИОТЕРАПИИ ТУБЕРКУЛЕЗА

- ▣ 1) Синтетические средства это средства узкого (собственно противотуберкулезного) спектра действия; антибиотики средства широкого спектра действия
- ▣ 2) Чаще всего противотуберкулезные средства оказывают туберкулостатическое действие.

Отдельные средства при высоких дозировках и длительном применении могут оказывать туберкулоцидное действие (это касается изониазида, рифампицина, стрептомицина и циклосерина)

- ▣ 3) К противотуберкулезным ср-вам достаточно быстро развивается устойчивость микобактерий туберкулеза, поэтому в процессе химиотерапии необходимо комбинировать средства из всех 3-х групп
- ▣ 4) Противотуберкулезная химиотерапия ведется длительно, это делает необходимым тщательный учет нежелательных побочных действий и их коррекцию

Изониазид

Спектр действия: внутриклеточные микобактерии туберкулеза и возбудитель проказы.

Механизм действия:

Нарушает синтез миколевых кислот, являющихся важнейшим структурным компонентом клеточной стенки микобактерий туберкулеза; угнетает синтез нуклеиновых кислот.

Тип действия: туберкулоцидный

Показания: все формы туберкулеза

Побочные эффекты: нейротоксичность на ЦНС - психастения и снижение порога судорожного реагирования (эпилепсия)

на уровне периферической нервной системы – полиневриты

Для преодоления нежелательных побочных действий изониазида на нервную систему применяют препараты витаминов В1 и В6

нарушение функций печени и почек

Противопоказания: эпилепсия; почечная и печеночная недостаточность

Этамбутол

Механизм действия: подавляет синтез нуклеиновых кислот (особенно РНК).

Тип действия: туберкулостатический

Показания: все формы туберкулеза (при устойчивости к препаратам I группы)

Побочные эффекты: нейротоксичность (невриты, поражение зрительного нерва)

нарушение функций печени и почек

Противопоказания: нарушение зрения
гепатиты

Циклосерин

Механизм действия: нарушает синтез клеточной стенки за счет структурного сходства с D-аланином, угнетает активность ферментов D-аланинрацемазы и D-аланинсинтетазы → нарушается образование дипептида D-аланил-D-аланина, необходимого для построения клеточной стенки бактерии.

Тип действия: бактерицидный

Показания:

- ▣ 1) туберкулез (назначают внутрь в сочетании с другими противотуберкулезными ср-вами)
- ▣ 2) острые инфекции мочевыводящих путей (нетуберкулезной этиологии)

Побочные эффекты:

- ▣ 1) влияние на ЦНС - психастения, снижение работоспособности, деменция, бред, психоз с суицидальными попытками
- ▣ 2) влияние на периферическую нервную систему - полиневриты (для борьбы с этим используются препараты витаминов B1 и B6)
- ▣ 3) застойная сердечная недостаточность
- ▣ 4) мегалобластическая анемия
- ▣ 5) аллергия

Противопоказания: почечная недостаточность; заболевания ЦНС

Натрия парааминосалицилат (ПАСК)

Механизм действия: конкурентный антагонизм с парааминобензойной кислотой, необходимой для роста и размножения микобактерий туберкулеза

Тип действия: бактериостатический

Показания: все формы туберкулеза

Побочные эффекты:

ульцерогенное действие

нарушения функций печени и почек

аллергические реакции

Тиоацетазон

Механизм действия: образует хелатные комплексы с ионами меди

Характеризуется весьма низким темпом развития устойчивости возбудителей туберкулеза

Показания: внелегочной туберкулёз, проказа.

Побочные эффекты:

угнетение кроветворения

поражение печени и почек

диспепсические расстройства

аллергические реакции

Комбинированные противотуберкулезные препараты

Число компонентов	Торговое название	Компоненты
2-компонентные	<i>Рифинаг</i>	рифампицин 0,15 г + изониазид 0,1 г рифампицин 0,3 г + изониазид 0,15 г
	<i>Фтизоэтам</i>	изониазид 0,15 г + этамбутол 0,4
	<i>Фтизопирам</i>	изониазид 0,15 г + пиразинамид 0,5 г
3-компонентные	<i>Рифакомб</i>	рифампицин 0,15 г + изониазид 0,1 г + пиридоксин 0,1 г
	<i>Рифатер</i>	рифампицин 0,15 г + изониазид 0,05 + пиразинамид 0,3 г
	<i>Майрин</i>	рифампицин 0,15 г + изониазид 0,075 г + этамбутол 0,3 г
4-компонентные	<i>Майрин П</i>	рифампицин 0,12 г + изониазид 0,06 г + этамбутол 0,225 г + пиразинамид 0,3 г



ПРОТИВОСПИРОХЕТОЗНЫЕ СРЕДСТВА



Противоспирохетозные средства

Противоспирохетозные препараты — препараты, активные в отношении сифилиса и других спирохетозов

Спирохеты ?



Научная классификация

Царство: **Бактерии**
Тип: **Spirochaetes**
Класс: **Spirochaetes**
Порядок: **Спирохеты**

Латинское название

Spirochaetales BUCHANAN, 1917

Семейства

- *Brachyspiraceae*
- *Brevinemataceae*
- *Leptospiraceae*
- *Spirochaetaceae*

Антибиотики пенициллинового ряда

- являются противоспирохетозными антибиотиками выбора. Предпочтительно использование пролонгированных форм. В ряде случаев при использовании ретарпена и экстенцилина можно ограничиться всего одной инъекцией.
- Не пролонгированные препараты (бензилпеницилин) назначаются в очень высоких дозах (по 1 млн. ед. 6-8 раз в сутки без ночного перерыва). При непереносимости антибиотиков выбора назначают антибиотики резерва.



Препараты висмута

Бийохинол - комбинированный препарат, содержит: висмут, йод, хинин, персиковое масло.

- ▣ Механизм действия - характеризуется слабой избирательностью действия, но при больших концентрациях блокирует сульфгидрильные группы тиоловых ферментов спирохет.
- ▣ Тип действия - статический
- ▣ Не всасывается из ЖКТ, вводится только внутримышечно.

Препараты мышьяка

- Механизм действия: блокирует сульфгидрильные группы тиоловых ферментов спирохет.
- Тип действия - статический
- Осарбон - используется как средство местной терапии в форме вагинальных суппозиториях (применяется для лечения сифилитических поражений влагалища, а также для терапии трихомонадного кольпита).

Спасибо за внимание!

