

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 *S. 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 поколение	V поколение
цефалоридин цефалотин цефапирин цефрадин цефазолин цефалексин цефадроксил	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 периоперационная 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:

- ✓ азакиды, 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

