

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  $\beta$ -лактамных антибиотиков, в основе химической структуры которых лежит 7-аминоцефалоспоровановая кислота (7-АЦК)

### Основная особенность

- ✓ большая резистентность по отношению к  $\beta$ -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 эфирь  
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  $\beta$ -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

