

---

**Синтетические противомикробные  
препараты разной химической структуры.**



# Классификация сульфаниламидов

## А. Системные сульфаниламиды

### I короткого действия $T_{0,5} < 8$ ч

- Sulfanilamida (streptocid)
- Sulfatiazol (norsulfazol)
- Sulfadimidina (sulfadimizina)
- Sulfaetidol (etazol)
- Sulfacetamida (sulfacil)
- Sulfacarbamida (urosulfon)

### II средней длительности $T_{0,5} = 8-24$ ч

- Sulfametoxazol
- Sulfafenazol
- Sulfadiazina (sulfazina)
- Комбинированные препараты
- Co-trimoxazol (biseptol, bactrim)
- Co-trimazina
- Antrima

### III длительного действия

$T_{0,5} = 24-48$  ч

1. Sulfametoxipiridazina  
(sulfapiridazina)
2. Sulfamonometoxina
3. Sulfadimetoxina
4. Sulfametoxidiazina

### Комбинированные препараты

1. Sulfaton

### IV свердлительного действия

$T_{0,5} = 60-120$  ч

- Sulfalen
- Sulfadoxina

# Классификация сульфаниламидов

---

## В. Сульфаниламиды действующие в кишечнике

- Ftalilsulfatiazol (ftalazol)
- Ftalilfapiridazina (ftazina)
- Sulfaguanidina (sulgina)
- Disulformina
- Succinilsulfatiazol
- **Азо-соединения**
- Salazosulfapiridina
- Salazosulfapiridazina
- Salazodimetoxina.

## С. Сульфаниламиды местного действия

- Sulfacetamida (sulfacilul)
- Sulfadiazina argentică
- Mafenid

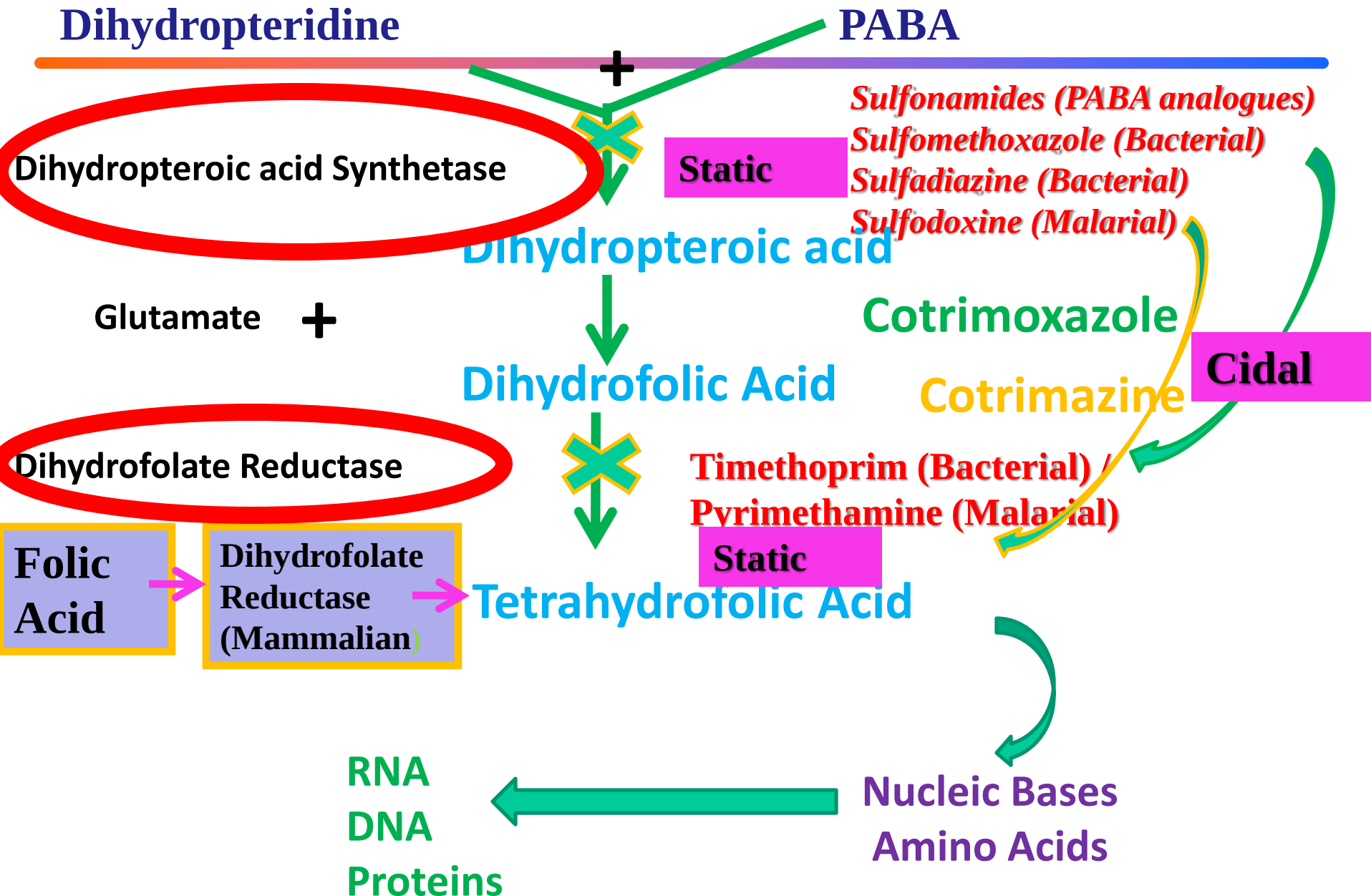
# Спектр действия

- **Грамм+бактерии** (streptococi, unele tulpini de stafilococi, pneumococi, bacilul antraxului)
- **Грамм-бактерии** (gonococi, meningococi, colibacili, salmonele, shigelle, bacilul influenței etc.);
- **Вибрионы холеры,**
- **Крупные вирусы** (agenții trachomei, psitacozei, ornitozei, limfогranulematozei),
- **Простейшие** (toxoplasme, plasmodiul malariei);
- **Патогенные грибки;**
- **актиномицеты;**
- **гистоплазмы; хламидии; нокардии; легионелы;**
- **пневмоцисты.**
- **Умерено чувствительны:**
  - enterococii, streptococii viridans,
  - klebsiiele, proteus, clostridiile, brucela,
  - micobacteriile leprei.

## МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ СУЛЬФАНИАМИДНЫХ ПРЕПАРАТОВ



# Sulfonamides (MOA)



# Показания

## Системные сульфаниамиды:

- тонзилиты, фарингиты, отиты, бронхиты, бронхоэктазии (SA de scurtă durată sau combine);
- Невмоцистная пневмония (preparatele combine);
- Инфекции желчевыводящих путей (sulfalen, sulfadimetoxina, sulfametoxipiridazina);
- Инфекции мочевыводящих путей (sulfacarbamida, SA de durată lungă și ultralungă);
- уросепсис (preparatele combine);
- Тяжелые инфекции вызванные chlamidii, toxoplasme, nocardii, plasmodiul malariei (SA combine, sulfamonometoxina, sulfametoxipiridazina);

## Сульфаниамиды действующие в кишечнике :

- Энтериты, колиты, энтероколиты (ftalilsulfatiazolul, ftalilfapiridazina, sulfaguanidina, disulformina, succinilsulfatiazolul);
- Неспецифический язвенный колит и болезнь Крона (azo-compușii).

## Сульфаниамиды местного действия:

- конъюнктивиты, блефариты, бленорея.
- Для промывания ран, полостей

# Побочные эффекты сульфаниламидов

---

## 1. аллергические (частые)

- лихорадка; кожные высыпания;
- Ангионевротический отек;
- Сывороточная болезнь;
- фотосенсибилизация;
- Аллергические васкулиты;
- Эксудативные эритемы (синдром Stevens-Sohnson, Layella)

## 2. гематологические (редко или очень редко)

- Гемолитическая анемия (идиосинкразия при дефиците глюкозо – 6 – фосфатдегидрогеназы);
- Апластическая анемия (токсического генеза);
- агранулоцитоз, тромбоцитопения (аллергического или токсического генеза).

## 3. диспептические (относительно частые)

- Анорексия, тошнота, рвота.

## 4. гепатиты

- Гепатит с диффузным некрозом.

# Sindromul Stivens-Djonson



# Sindrom Layella



Рисунок 1



# Побочные эффекты сульфаниламидов

---

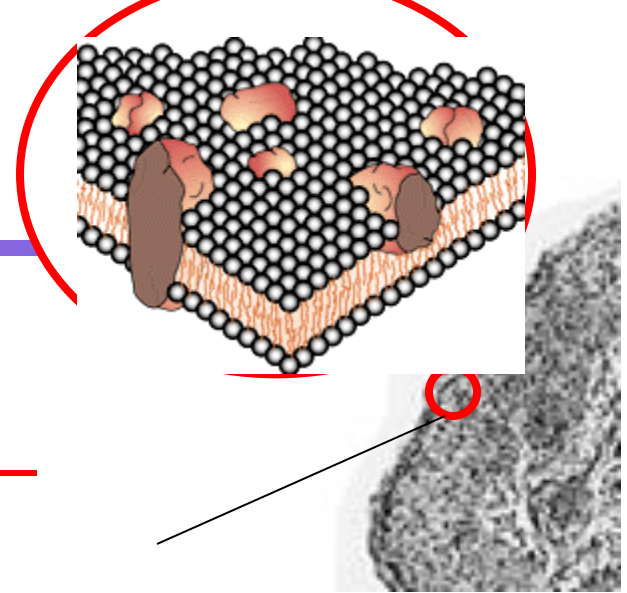
## 5. почечные

- кристалурия,
- гематурия,
- колики, обструкция почек с олиго- или анурией;
- Некроз канальцев (аллергического или токсического генеза);

## 6. разные (редко или очень редко)

- Гипо- или гипертироидизм;
- полиневриты,
- депрессия, шум в ушах, атаксия;
- судороги;
- Психические нарушения (иногда острые);
- Билирубиновая энцефалопатия (гипербилирубинемия из-за конкуренции в процессе конъюгирования и взаимодействия с белками плазмы).

# Нитрофураны



## **A. Резорбтивного действия –**

- Nitrofurantoina (furodonina)*,
- Nitrofurazone (furacilina)*;
- Furazidone (furagina)*;
- Nifuratel (macmiror)*;
- Nifurtimol*

## **B. Кишечного действия**

- *nifuroxazide; furazolidone*

## **C. Местного действия –**

- nitrofurazone (furacilina); furazidone (furagina)*

# Спектр действия

---

1. бактерии Gram “+” și Gram “–”  
*stafilococi, streptococi, enterococi, pneumococi, meningococi, colibacilul, salmonelle, sighele, klebsiele, aerobacter, bacilul antrax, protei, v. holerei, anaerobi;*
2. простейшие: *trichomonade, lamblii*
3. грибки: - *candida*

# Механизм действия

**А.** У микроорганизмов редуктазы восстанавливают нитрогруппу с образованием токсичных веществ, которые влияют на клеточную стенку, необратимо ингибируют НАДФ, цикл Кребса и другие биохимические процессы с дисфункцией цитоплазматической мембраны и бактерицидным действием.

**Б.** Нитрофураны, а также их метаболиты могут образовывать комплексы с нуклеиновыми кислотами, что приводит к угнетению синтеза белка и бактериостатическому эффекту соответственно.

**В.** являясь акцептором кислорода, нарушает процессы тканевого дыхания.

**Г.** может ингибировать ряд ферментов, ацетилкоэнзим А, глутатионредуктазу, пируватоксидазу, альдегиддегидрогеназу.

**Д.** могут активировать процессы перекисного окисления липидов у микроорганизмов с их повреждением.

# Показания нитрофуранов

---

**А. Инфекции мочевыводящих путей** (препараты II линии, в основном для профилактики рецидивирующих инфекций)

- Nifurtoinol ,Nifuratel , Furazidina, Nitrofurantoina

**В. Кишечные инфекции** (энтериты, энтероколиты, пищевые токсикоинфекции, лямблиоз, трихомонадоз, острая бактериальная дизентерия)

- Furazolidona      Nifuroxazida

**С. Инфекции кожи и мягких тканей** (гнойные раны, язвы, ожоги II-III ст., остеомиелит, эмпиема плевры, гнойный артрит, анаэробная инфекция кожных ран, фурункул наружного уха, промывания при перитоните, промывания и перевязка ранб полоскания при стоматологических манипуляциях).

- Nitrofurallul      Furazidina

## **противопоказания**

- *почечная недостаточность;*
- *дети до 1 года;*
- *дефицит глюкозо-6 -фосфатдегидрогеназы;*
- *беременность (ultimul trimestru)*
- *повышенная чувствительность;*
- *сочетание с налидиксовой кислотой*

## **Побочные эффекты**

- **диспептические:** *тошнота, рвота, колики, диарея, холестатическая желтуха;*
- **аллергические:** *сыпь, зуд, ангионевротический отек, острый (кашель, лихорадка, эозинофилия) или хронический легочный синдром (интерстициальный фиброз)*
- **неврологические:** *головная боль, головокружение, нистагм, атаксия, парестезии,*
- **другие** — *гемолитическая и мегалобластическая анемия, синдром красной волчанки.*

# Производные хинолонов

## 1. Нефторированные хинолоны I поколения

*I поколения* - Acidul nalidixic,

*II поколения*, Acidul oxolinic, Acidul pipemidic,  
Rosoxacina,

## 2. Фторхинолоны - II поколения

### A. монофторхинолоны

*I поколения* - ciprofloxacin, ofloxacin, norfloxacin,  
refloxacin, enoxacin.

*II поколения* : moxifloxacin, levofloxacin.

### B. дифторхинолоны

Lomefloxacin, difloxacin, sparfloxacin,

### C. трифторхинолоны

Fleroxacin, tosufloxacin, temafloxacin

# ОСНОВНЫЕ ГРУППЫ И ПРЕПАРАТЫ ФХ

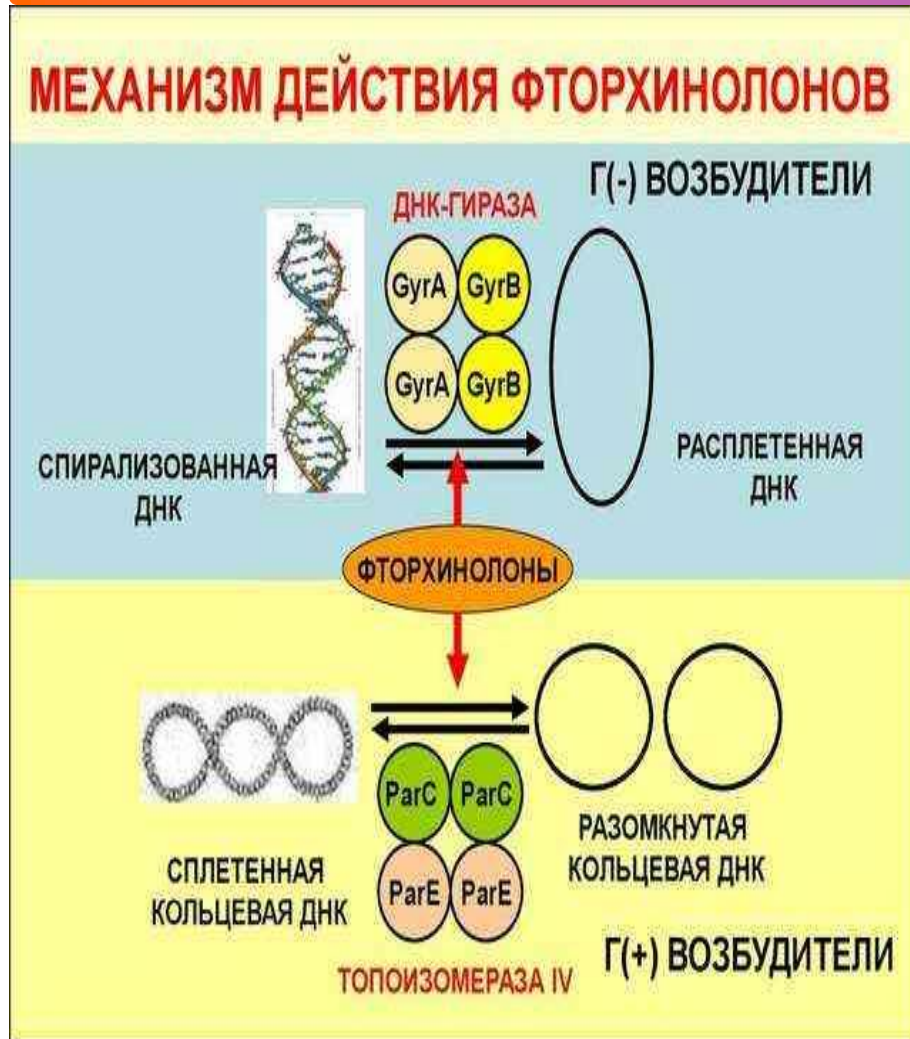


# КЛАССИФИКАЦИЯ ФТОРХИНОЛОНОВ

| Поколение                       | Гр (-) | Гр (+) | Атипич-<br>ные м/о | Анаэро-<br>бы | Особенности<br>применения                            |
|---------------------------------|--------|--------|--------------------|---------------|------------------------------------------------------|
| Налидиксовая<br>кислота         | ++     |        |                    |               | Инфекции МВП                                         |
| II поколение                    |        |        |                    |               |                                                      |
| Норфлоксацин                    | +++    | -      | -                  | -             | Инфекции МВП                                         |
| Пефлоксацин                     | +++    | -      | ++                 | -             | Гинекология, хирургия                                |
| Ципрофлоксацин                  | +++    | -      | ++                 | -             | и т.д.                                               |
| Офлоксацин                      | +++    | ++     | +++                | -             | Офлоксацин может<br>применяться при<br>инфекциях НДП |
| III поколение                   |        |        |                    |               |                                                      |
| Левифлоксацин<br>Спарфлоксацин  | +++    | +++    | +++                | -             | Гинекология, хирургия,<br>пульмонология и т.д.       |
| IV поколение                    |        |        |                    |               |                                                      |
| Моксифлоксацин<br>Гемифлоксацин | +++    | +++    | +++                | +++           | Не требуется<br>комбинации с<br>метронидазолом       |

НДП – нижние дыхательные пути, МВП – мочевыводящие пути

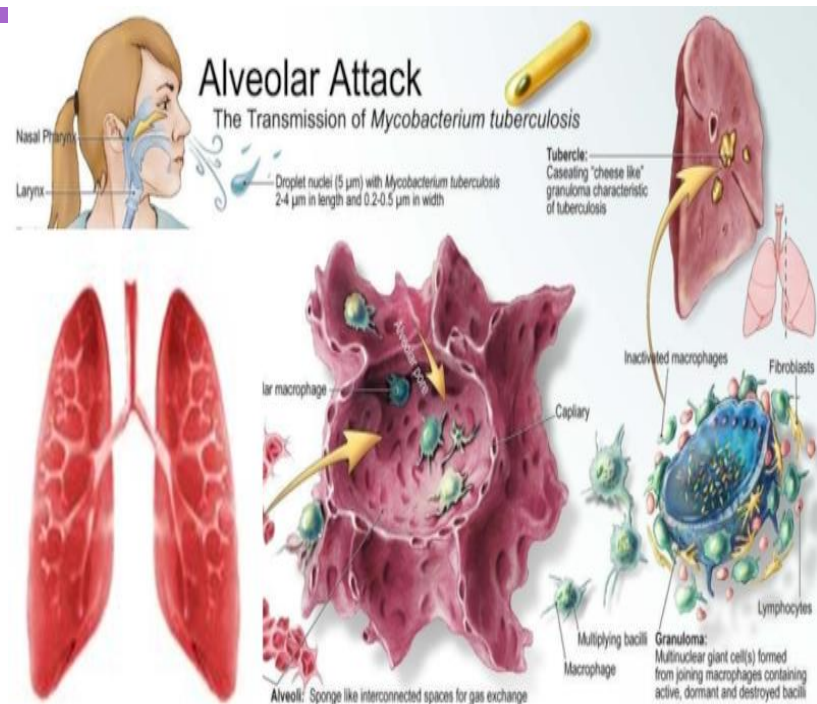
# Механизм действия.



**Фторхинолоны блокируют ДНК-гиразу (топоизомеразу II) и ДНК-топоизомеразу IV бактерий, нарушая транскрипцию и репликацию ДНК и синтез белков РНК соответственно. Это проявляется в подавлении роста и размножения бактерий.**

# Фармакокинетические особенности фторхинолонов

- Хорошо проникают в микробные клетки;
- Высокая биодоступность при приеме внутрь;
- Большой объем распределения - ;
- Высокие концентрации в тканях;
- Хорошо проникают во внесосудистые жидкости;
- Накапливаются в макрофагах;
- Медленное выведение из организма;
- Не кумулируют при длительном применении.



«ФХ» - хорошо проникает в ткани – его уровень в ткани легкого в 25 раз превышает концентрацию в крови. В жидкости на поверхности эпителия нижних дыхательных путей и в слизистой околоносовых пазух он накапливается в концентрации в 12 раз большей, чем МИК для *S.pneumoniae*.

# Показания

- **инфекции мочевыводящих путей** неосложненные и осложненные; бактериальный простатит;
- **гонококковые инфекции** (уретрит, проктит, цервицит);
- **кишечные инфекции** (диарея путешественников, гастроэнтерит, бактериальная дизентерия, тифоидная лихорадка);
- **инфекции дыхательных путей** (обострение хр.бронхита, нозокомиальные пневмонии);
- **хр. остеомиелит**;
- **Инфекции кожи** вызванные грам-отрицательными бактериями;
- **Профилактика инфекций грам- бактериями у больных нейтропенией**
- **Туберкулез легких** (ofloxacin, ciprofloxacin, lomefloxacin);
- **Атипичные инфекции** (chlamidii, micoplasma, ureaplasma).

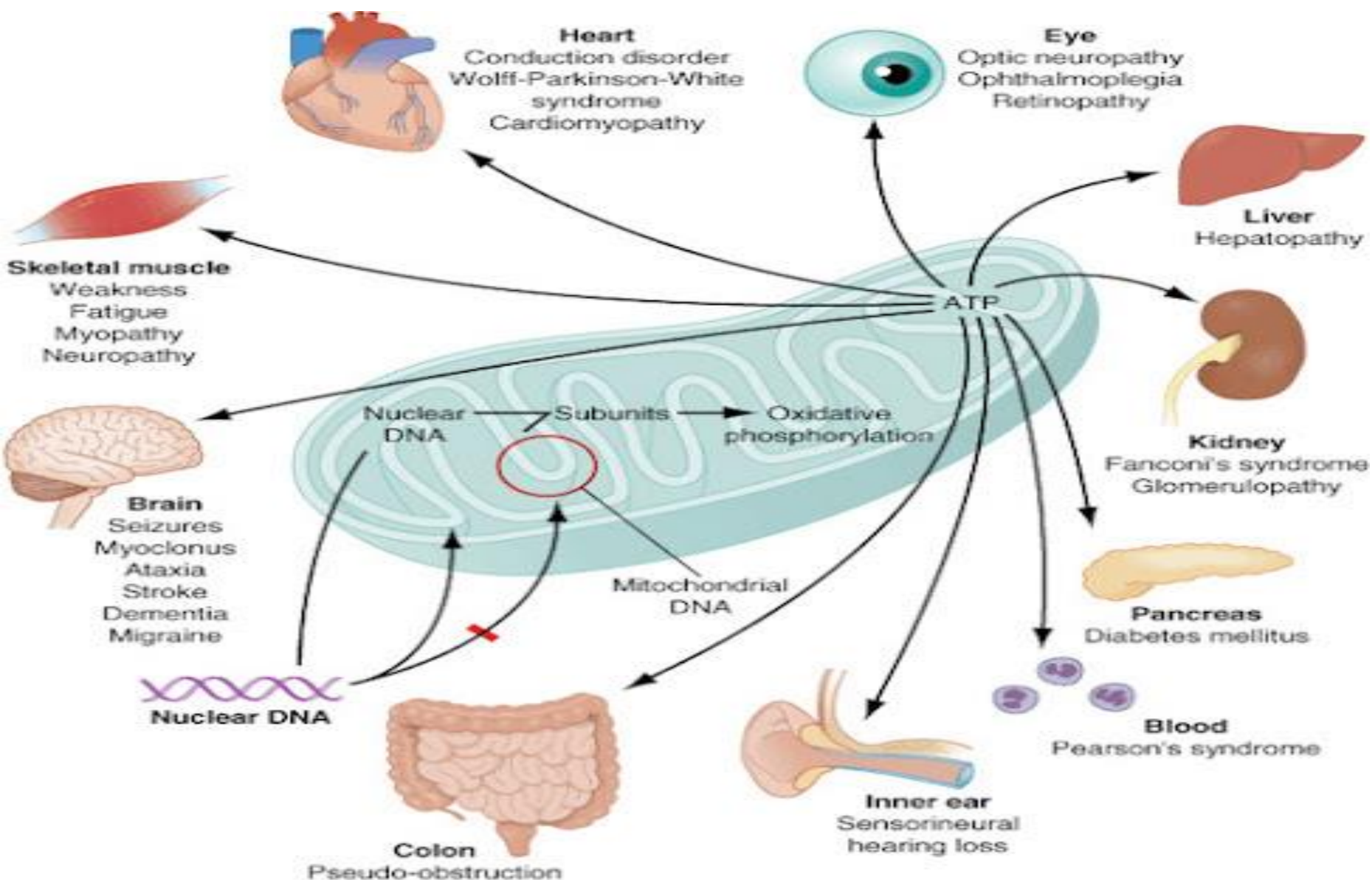
# Противопоказания:

- беременность(I триместр),
- лактация
- Дети до полового созревания
- Дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы
- эпилепсия
- Выраженная почечная и ипеченочная недостаточность
- Прбывание на солнце

## Побочные эфффекты

- **ЖКТ**- тошнота, рвота, редко псевдомембранозный колит;
- **ЦНС** – судороги, делир, галюцинации;
- **кровь** – лейкопения, эозинофилия;
- **аллергические**– зудящая сыпь, крапивница, фотосенсибилизация, ангионевротический отек, анафилактические реакции, васкулит;
- **Костей** – эрозии и повреждения хрящей;
- Другие** - кристаллурия, гематурия, интерстициальный нефрит, острая почечная недостаточность.

# Митохондриальная токсичность фторхинолонов



# *Производные нитроимидазола*

## Монокомпонентные препараты

### **А. Системного действия**

metronidazol (trihopol, flagic, metrogil, etc.),  
nimorazol (naxodjin),  
tinidazol (fasigin, tinimed, tiniba etc.),  
ornidazol (tiberol)  
secnidazol

### **В. Местного действия**

- Aminitrozol, - metronidazol

### **Комбинированные препараты**

- **Helicocina** (metronidazol + amoxicilină);
- **ginalgina** (metronidazol + clorchinaldol);
- **clion-D** (metronidazol + miconazol);
- **terjinan** (metronidazol + nistatin + neomicină + prednisolon);
- **trichomicon** (metronidazol + cloramfenicol + nistatină + lactază)
- **Metrogil denta (metronidazol+clorhexidina);**
- **medozol** (metronidazol + clotrimazol + neomicină + hexestrol + azulena);

# Нитроимидазолы

## Спектр активности:

### Простейшие

**Трихомонады** (*Trichomonas vaginalis*),

**Гарднереллы** (*Gardenerella vaginalis*)

**Лямблии** (*Lambliia intestinalis*, *Giardia lamblia*),

**Амебы** (*E.histolytica*),

***Blastocystis hominis*, *Balantidium coli*,**

**Лейшмании** (*Leishmania* spp.).

### Облигатные и факультативные анаэробы

(Грам «+», Грам «-», микроаэрофилы)

**Бактероиды** (включая *Bacteroides fragilis*),

**Клостридии** (включая *Clostridium difficile*),

**Фузобактерии, Эубактерии, Пептострептококки, Пептококки** (*P.niger*),

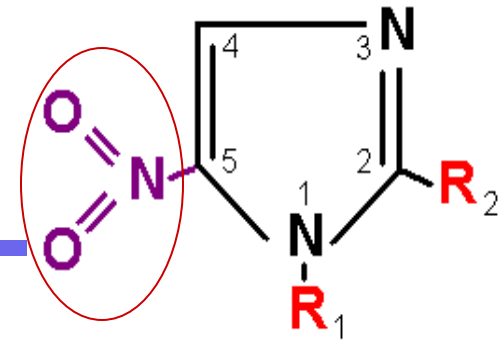
**Гарднереллы** (*G.vaginalis*).

**Не влияет на: аэробные бактерии, микобактерии, грибы, вирусы и прионы**

# Mecanismul de acțiune

1. Селективное поглощение анаэробными возбудителями с предотвращением производства водорода, лишая анаэробов восстановительных эквивалентов, путем блокирования определенных метаболических процессов.
2. В анаэробных условиях происходит восстановление нитрогруппы с участием ферредоксина. Полученные продукты взаимодействуют с различными внутриклеточными макромолекулами с их повреждениями, включая повреждение цепи ДНК. Обнаружена особая чувствительность тимидина к производным нитромидазола.

# МЕХАНИЗМ ЦИТОТОКСИЧЕСКОГО ДЕЙСТВИЯ ИМИДАЗОЛОВ



Восстановление нитрогруппы микробными  
нитроредуктазами в анаэробных условиях

- Синтез свободных радикалов, повреждающих ДНК
- Нарушение репликации и транскрипции ДНК →
- Угнетение синтеза белка и деградация микробной ДНК
- Нарушение клеточного дыхания

# Показания к применению

- трихомониаз, лямблиоз (лямблиоз), балантидиаз, гарднереллез;
- амебиаз всех форм, включая амебную дизентерию, печеночный амебиаз;
- внутрибрюшные анаэробные инфекции (абсцессы, перитонит),
- абсцессы головного мозга, менингит;
- пневмония, абсцессы легких, эмпиема плевры,
- эндокардит, сепсис;
- инфекции костей, суставов, кожи и мягких тканей головы и шеи,
- инфекции органов малого таза,
- псевдомембранозный колит (диарея, вызванная *C. difficile*);
- язвы желудка и двенадцатиперстной кишки (инфекции *H. pylori*);
- смешанные аэробные и анаэробные инфекции (в сочетании с антибиотиками);
- профилактика анаэробных инфекций во время операций, гинекологии;
- в стоматологической практике: при анаэробных инфекциях полости рта - острый и хронический гингивит, острый язвенно-некротический гингивит Венсана, ящур, хейлит, постэкстрактивный альвеолит, острый и хронический пародонтит, пародонтит с гингивитом, воспалительные заболевания полости , воспалительные заболевания полости и пародонтальный абсцесс (в комплексном лечении).

# Фармакокинетика производных нитроимидазола

- **Всасывание** (быстрая, хорошая и полная) пища не влияет на всасывание;
- **Биодоступность** 90%;
- **Распределение** (спинномозговая жидкость, мозг, желчь, абсцессы, плацента, молоко, моча)
- **Связывание с белками** - низкое (5-20%);
- C<sub>max</sub> через 1-3 часов;
- T<sub>0,5</sub> - 6-14 часов;
- **Метаболизм** - интенсивно метаболизируются путем окисления с образованием нескольких метаболитов, затем возможно конъюгирование с глюкуроновой кислотой. Некоторые метаболиты активны и составляют около 50-30% от исходного препарата.
- **Выведение** - с мочой и/или желчью в виде метаболитов или в неизмененном виде (тинидазол) в течение 24 часов.



## **Противопоказания**

- органические нарушения головного мозга;
- тяжелые заболевания печени;
- беременность с осторожностью (избегать в первом триместре и родах);
- кормление грудью;
- сочетание с алкоголем – дисульфирамовая реакция;
- повышенная чувствительность к препаратам.

# Побочные эффекты

- **расстройства пищеварения:** анорексия, тошнота, горечь и металлический вкус, рвота, диарея, боли в животе, преходящее повышение уровня трансаминаз и билирубина;
- **неврологические:** головная боль, головокружение, возбудимость, слабость, неврит, парестезии, головокружение, атаксия, бессонница, депрессия, энцефалопатия, судороги, припадки тройничного нерва;
- **аллергические реакции:** кожный зуд, крапивница, сыпь;
- **иногда:** нейтропения;
- **В/в** – флебиты, раздражение
- **реакции дисульфирамского типа** (в сочетании с алкоголем); мутагенные и канцерогенные реакции (у экспериментальных животных).
- **Нарушения со стороны полости рта:** глосситы, стоматиты, обычно вызванные развитием кандидоза;

## **Пр. хиноксалина:** *Chinoxidina Dioxidina*

### **Спектр действия:**

Proteus, P.aeruginosa, Klebsiella, Bac.Fridlender, E.coli, Salmonella, Staphylococcus, Streptococcus, Clostridium antracis

**Показания:** гнойные процессы брюшной полости, кожных покровов, цистит, холецистит, холангит, абсцесс легкого, эмпиема легких, сепсис грамм "-"

**Побочные эффекты:** диспептические расстройства, головная боль, головокружение, озноб, фибрилляция мышц.

**Особенности использования:** Хиноксидин назначают по 0,25 3-4 раза / сут после еды. Диоксидин менее токсичен: в / в при сепсисе (особенно стафилококки и пиоциановая палочка); 1% раствор только для взрослых для промывания мочевого пузыря после катетеризации.

# Пр.8-оксихинолина

**А. Кишечного действия:** clorchinaldol, cliochinol, diiodoxochinolina.

- бактерии gram negativі; простейшие, амеба, грибы

**В. Резорбтивного действия:** - nitroxolina.

бактерии gram „+” (cocci, bacilli) și gram „-” трихомонады, грибы.

**С. Местного действия:** - clorchinaldol.

Бактерии gram „+” și gram „-” амебы, лямблии, грибы.

## Механизм действия:

1. Подавляет бактериальный синтез ДНК, возможно, РНК, а также белков (бактериостатический эффект)
2. Комплексообразование с ионами металлов, которые строго необходимы для активности ферментов микроорганизмов (бактерицидный эффект).

# Nitroxolina

## Показания:

- **острые и хронические инфекции мочевыводящих путей (уретрит, цистит, пиелит, пиелонефрит, простатит);**
- **профилактика инфекционных осложнений после диагностических и лечебных процедур (катарсис, цистоскопия), в послеоперационном периоде на мочеточниках и мочевыводящих путях**

## Противопоказания:

- *заболевание почек с олиго- или анурией;*
- *тяжелые заболевания печени;*
- *катаракта;*
- *невриты, полиневриты;*
- *дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;*
- *беременность (III семестр);*
- *чувствительность к хинолину.*



## Побочные эффекты:

- иногда возникает тошнота, рвота, снижение аппетита;
- высыпания очень редко;
- Иногда: парестезии, полинеервит, заболевание глазодвигательного нерва, миелопатия, тахикардия, атаксия, головная боль, нарушение функции печени, окрашивание мочи в оранжево-желтый цвет.

## Фармакокинетика.

- Хорошо всасывается из ЖКТ.
- Быстро выводится из крови в мочу.
- Не метаболизируется, а выводится в неизмененном виде с мочой.
- Минимальные бактериостатические концентрации после однократного приема сохраняются в течение 3 часов, а после 0,4 г - 7 часов.

# Clorchinaldol, cliochinol

## **Показания:**

- бактериальные, амёбные и грибковые кишечные инфекции, амёбная дизентерия (хлорхинальдол, клиохинол);
- инфицированные раны, пролежни и кожные микозы (хлорхинальдол);
- Заболевания влагалища, вызванных чувствительными микробами (хлорхинальдол).

## **Противопоказания.**

- Чувствительность к препарату
- заболевания щитовидной железы.

## **Побочные эффекты**

- дискомфорт в эпигастрии, тошнота, рвота, диарея, головная боль;
- Явления йодизма, изредка увеличение щитовидной железы
- Очень редко: синдром «миелопической невропатии» с неврологическими, вегетативными, психическими, зрительными нарушениями;
- Покалывание и зуд во влагалище

# **Oxazolidindionele**

## **linesolid, eperesolid**

---

### **Mecanismul de acțiune.**

- **Preparatele din această grupă sunt inhibitori selectivi ai sintezei proteinelor prin cuplarea cu subunitățile 30S și 50S ale ribosomilor celulelor microbiene, prin blocarea includerii ARN-t, preîntâmpină formarea complexului inițiator al subunității 70S, cu dereglarea translării proteinelor.**
- **Față de majoritatea microbilor manifestă efect bacteriostatic, iar față de streptococci și anaerobi – bactericid.**
- **Oxazolidindionele, la concentrații de 2-4 ori mai mici decât concentrațiile minime inhibitorii, inhibă expresia factorilor virulenței eliberați de S.aureus și Str.pyogenes; reduce producerea alfa-hemolizinei și coagulazei de S.aureus; precum și streptolizinei și ADN-azei de Str.pyogenes.**

# Oxazolidindionele

## linesolid, eperesolid

### Механизм действия.

- Препараты этой группы являются селективными ингибиторами синтеза белка путем связывания с 30S и 50S субъединицами рибосом микробных клеток, блокируя включение т-РНК, предотвращая образование начального комплекса субъединицы 70S, с нарушением трансляции белка. По отношению к большинству микробов проявляет бактериостатическое действие, а по отношению к стрептококкам и анаэробам - бактерицидное.
- Оксазолидиндионы в концентрациях в 2-4 раза ниже минимальных ингибирующих концентраций подавляют экспрессию факторов вирулентности, выделяемых *S.aureus* и *Str.pyogenes*; снижает выработку альфа-гемолизина и коагулазы *S.aureus*; а также стрептолизина и ДНКазы *Str.pyogenes*.

# Оксазолидидиноны

## Спектр действия.

### Грам-+ аэробная флора:

- **стафилококки:** *S.aureus*, *S.epidermidis* și *S.spp.*) **включая оксациллин- и ванкомицинрезистентные штаммы**
- **стрептококки:** *Str.pyogenes*, *Str.pneumoniae*, *Str.viridans*, резистентные к антибиотикам
- **энтерококки** (*E.faecalis*, *E,faecium*), **включая ванкомицинрезистентные штаммы**
- **коринебактерии** (*Corynebacterium spp.*),
- **столбняк** (*Bacillus spp.*);
- **листерии** (*Listeria monocytogenes*) и **нокардии** (*Nocardia spp.*);

### Анаэробная флора:

- **клостридии** (*Cl.perfringens*, *Cl.difficile*);
- **пептострептококки** (*Peptostreptococcus spp.*);
- **фузобактерии** (*Fusobacterium meningosepticum*),
- **превотелы** (*Prevotella spp.*);
- **бактероиды** (*Bac.fragilis*).

**Микобактерии** - *M.tuberculosis*

# Показания оксазолидиндионов

Оксазолидиндионы в основном используются при инфекциях, вызванных аэробной и анаэробной грамположительной флорой различных локализаций (легких, мочевыводящих путей, кожи и мягких тканей, костей, эндокардит, сепсис и т. д).

- **стафилококковые инфекции (с полирезистентностью),**
- **энтерококковые инфекции (с полирезистентностью),**
- **стрептококковые инфекции (с полирезистентностью),  
обычно внутрибольничные, бактериологически  
подтвержденные.**
- При наличии подтвержденной или подозреваемой грамотрицательной инфекции они могут быть связаны с противомикробными препаратами, активными против этих микробов.
- **Туберкулез легких**

# Оксазолидидины

## Фармакокинетика.

- быстро всасывается с биодоступностью 100%,
- Смакс. через 1-2 часа.
- Связывание с белками плазмы составляет 31%.
- Кажущийся объем распределения ( $V_d$ ) равен 40-50 мл/м<sup>2</sup>.
- Препарат проникает во все жидкости и ткани организма, в том числе проникает через гематоэнцефалический барьер в очаг воспаления, миокард, сердечные клапаны.
- Линезолид в организме метаболизируется путем окисления без участия изоферментов цитохрома Р-450 с образованием 2 неактивных метаболитов.
- Препарат выводится с мочой и фекалиями примерно на 80-85% после однократного приема и примерно на 7-12% в течение 7 дней. Период полувыведения составляет 4,5-5,5 часа у взрослых и 3-3,7 часа у детей.

# Оксазолидидиноны

## Режим дозирования.

- Линезолид (таблетки 0,4 г и 0,6 г) у взрослых: можно вводить внутрь независимо от массы тела по 600 мг каждые 12 часов, а детям старше 5 лет (гранулы для суспензии 100 мг / 5 мл) - 10 мг / кг (не более 600 мг) каждые 8-12 часов. .
- Концентрат в пачках (по 100 мл, 200 мл и 300 мл по 2 мг / мл или 0,2% раствор) вводят внутривенно инфузией в течение 20-30 минут по 600 мг каждые 12 часов, а детям - по 10 мг / кг. , не превышая дозу 600 мг каждые 8-12 часов.

# Оксазолидидины

## Противопоказания и меры предосторожности:

- у пациентов с анемией и тромбоцитопенией,
- во время беременности и кормления грудью (по строгим показаниям)
- при аллергии на препарат.

## Побочные эффекты:

При применении линзолида побочные эффекты редки и незначительны и не требуют отмены лечения.

Могут отмечаться:

- ❖ насморк, рвота и диарея;
- ❖ изменение цвета языка;
- ❖ кандидоз полости рта;
- ❖ боль в месте укола;
- ❖ псевдомембранозный колит, вызванный *C.l.difficile*;
- ❖ тромбоцитопения;
- ❖ головная боль, бессонница, головокружение; кожная сыпь.

# Производные тиосемкарбазона

## Ambazona (faringosept)

- бактериостатическое действие в отношении гемолитических и зеленящих стрептококков, пневмококков .;
- Показания: острые инфекции полости рта и глотки (фарингит, ангина, тонзиллит, стоматит) с целью профилактики и лечения .;
- побочные эффекты: возможны аллергические реакции в виде сыпи.

## Pronilidul (falimint)

- *оказывает антисептическое, слабое обезболивающее, отвлекающее действие (вызывает ощущение холода в полости рта с угнетением кашлевых рефлексов и др.) и дезодорант.*
- *Показан как вспомогательное средство при воспалительных процессах полости рта и глотки; подготовка пациентов к манипуляциям в полости рта; неприятном запахе изо рта.*

# Родственные препараты:

- **fitosept, cameton, camfomen, septolete, laripront**

- В большинстве из них активный компонент - антисептик из группы катионных детергентов.

**Препараты могут выполнять следующие действия:**

- местноанестезирующее (гексализ);
- противокашлевое (септолете)
- антисептическое (фитосепт, каметон, камфомен, септолете, ларипронт, гексализ)
- дезодорирующее (фитосепт, септолете, ларипронт, гексализ)
- противовоспалительное (каметон, камфомен, септолете, ларипронт, гексализ)
- регенерирующее ( );
- противовирусное (ларипронт)
- кровоостанавливающее (ларипронт, фитосепт)

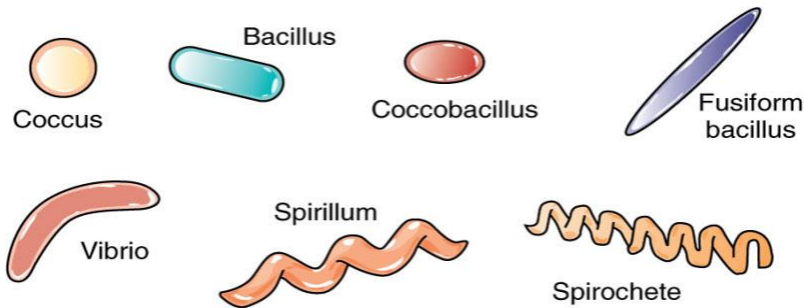
## Показания к применению:

- воспалительные и инфекционные заболевания полости рта, гортани и глотки
- ОРЗ, сопровождающиеся изменением тембра голоса (септолете, фитосепт)
- Галитоз - неприятный запах изо рта - (септолете, ларипронт, гексализ, фитосепт)
- ринит (каметон, канефобен)
- пародонтит (фитосепт)
- ожоги, язвы слизистой оболочки полости рта (фитосепт)
- раздражающий, непродуктивный кашель (септолете)
- подготовка к инструментальным исследованиям в полости рта.

Благодарю за внимание!

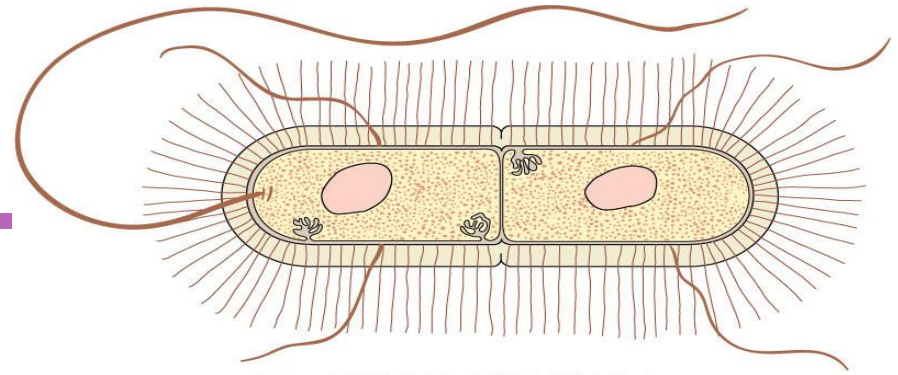


## Bacterial Morphology Shapes



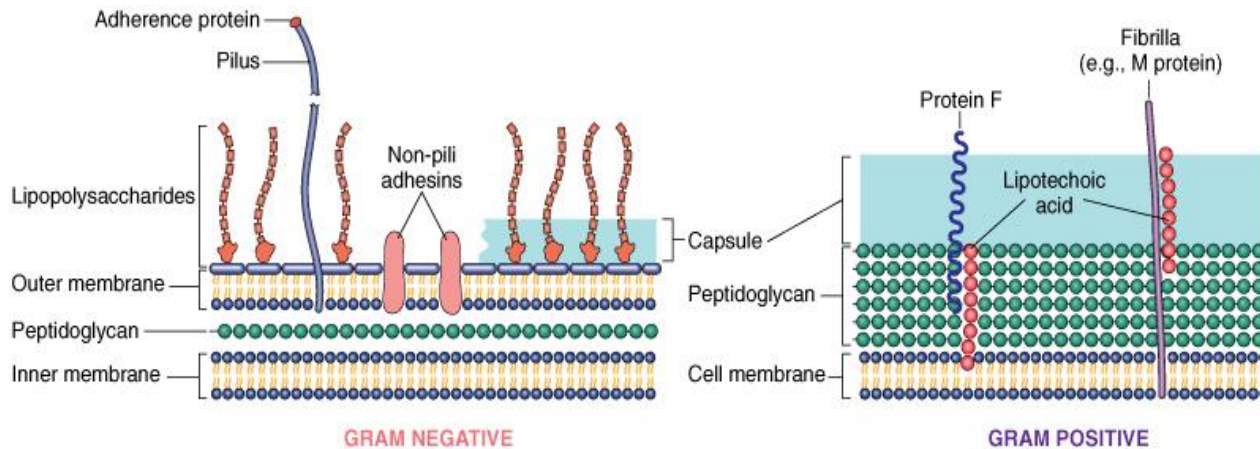
(From Murray PR et al: Medical microbiology, St Louis, 2002, Mosby.)

Fig. 37-1. General morphology of bacteria.



(From Greenwood D et al: Medical microbiology, ed 16, Edinburgh, 2002, Elsevier Science.)

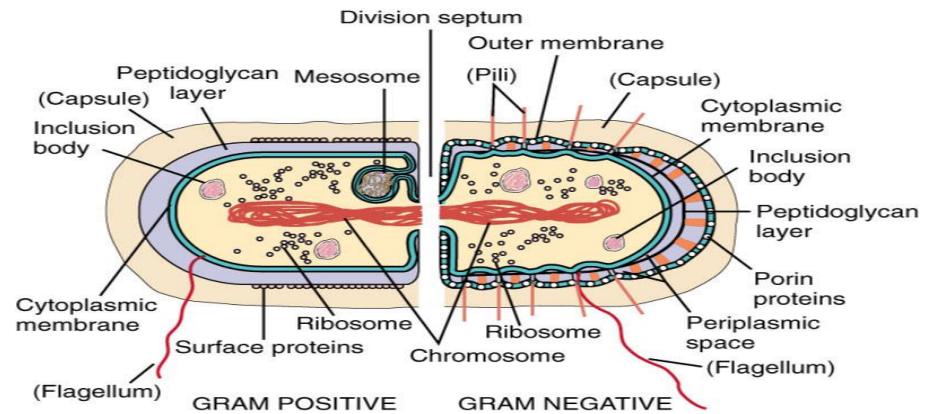
Fig. 37-2. A dividing bacterial cell with a single flagellum, four sex pili, numerous common pili, a cell wall, a cytoplasmic membrane, two nuclear bodies, three mesosomes, and numerous ribosomes.



| Gram Positive<br><i>Staphylococcus aureus</i> | Gram Negative<br><i>Escherichia coli</i> |
|-----------------------------------------------|------------------------------------------|
| Step 1 Crystal Violet                         |                                          |
| Step 2 Gram's Iodine                          |                                          |
| Step 3 Decolorizer (Alcohol or Acetone)       |                                          |
| Step 4 Safranin Red                           |                                          |

(From Murray PR et al: Medical microbiology, St Louis, 2002, Mosby.)

Fig. 37-3. Gram-stain differentiation of bacteria. The crystal violet of Gram stain is precipitated by Gram iodine and is trapped in the thick peptidoglycan layer in gram-positive bacteria. The decolorizer disperses the gram-negative outer membrane and washes the crystal violet from the thin layer of peptidoglycan. Gram-negative bacteria are visualized by the red counterstain.



(From Murray PR et al: Medical microbiology, St Louis, 2002, Mosby.)

Fig. 37-4. Gram-positive and gram-negative bacteria. A gram-positive bacterium has a thick layer of peptidoglycan (left). A gram-negative bacterium has a thin peptidoglycan layer and an outer membrane (right). Structures in parentheses are not found in all bacteria.