

Лекция №1

Стабилизаторы мембран тучных клеток

Стабилизаторы мембран тучных клеток – это лекарственные средства, которые противодействуют поступлению кальция в тучные клетки и приводят, таким образом, к уменьшению выработки гистамина. Они оказывают противоаллергическое влияние на организм, устраняют отек слизистой бронхов. Некоторые лекарства данной группы осуществляют и антигистаминное воздействие. Они связываются с гистаминочувствительными рецепторами различных тканей и органов и действуют аналогично H₁-гистаминоблокаторам.

Кетотифен

Действующее вещество: кетотифена фумарат.

Фармакологическое действие: стабилизатор мембран тучных клеток, невыраженный H₁-гистаминоблокатор. Угнетает астматическую реакцию на аллергические раздражители. Используется для профилактики бронхоспазма.

Показания: профилактика и лечение аллергических заболеваний, в их числе – бронхиальная астма, аллергический бронхит, крапивница, кожные высыпания.

Противопоказания: повышенная чувствительность к препарату, беременность, период кормления грудью.

Побочные действия: сонливость, вялость, головокружение, замедленная реакция, повышенная усталость, нервозность, нарушение сна. Сухость в ротовой полости, тошнота, рвота, задержка стула.

Способ применения: внутрь во время еды взрослым и детям от 3 лет – по 1 мг 2 раза в сутки; детям от 6 месяцев до 3 лет – по 0,5 мг 2 раза в сутки; детям до 6 месяцев – в виде сиропа по 0,05 мг/кг массы тела 2 раза в сутки.

Форма выпуска: таблетки по 1 мг, в блистере – 15 штук. Капсулы по 1 мг, 60 штук в упаковке. Сироп – флаконы по 60 или 100 мл (в 5 мл – 1 мг).

Особые указания: в период лечения препаратом не следует управлять автомобилем и заниматься потенциально опасными видами деятельности, требующими высокой концентрации внимания и быстрой реакции. С особой осторожностью назначать при эпилепсии и нарушениях работы печени.

Интал

Действующее вещество: кромоглициевая кислота.

Фармакологическое действие: средство против аллергии, стабилизатор мембран тучных клеток, предотвращает спазм бронхов. Продолжительная терапия способствует снижению частоты приступов бронхиальной астмы.

Показания: профилактика и лечение бронхиальной астмы, хроническая обструктивная болезнь легких.

Противопоказания: повышенная чувствительность к препарату, беременность на ранних стадиях, период кормления грудью, детский возраст (до 5 лет – для аэрозоля; до 2 лет – для порошковых ингаляций).

Побочные действия: охриплость голоса, кашель, сухость в ротовой полости, головокружение, головные боли, аллергические реакции.

Способ применения: ингаляционно. Порошок для ингаляций взрослым и детям – по 1 капсуле 4 раза в сутки (1 ингаляция обязательна перед сном). Аэрозоль для ингаляций взрослым и детям старше 5 лет – по 2 дозы (2—10 мг) 4 раза в сутки. Раствор для ингаляций взрослым и детям – по 20 мг 4 раза в сутки. После достижения необходимого эффекта не рекомендуется резко прекращать терапию, отменять препарат в течение недели.

Форма выпуска: аэрозоль для ингаляций, в баллонах – 112 доз (5 мг/доза), 200 доз (1 мг/доза). Капсулы с порошком для ингаляций по 20 мг, 10 штук в блистере. Раствор для ингаляций в ампулах по 2 мл (в 1 мл – 10 мг).

Особые указания: баллон нельзя прокалывать или подносить к огню, так как содержимое находится под давлением.

Тайлед минт

Действующее вещество: недокромил натрия.

Фармакологическое действие: средство против аллергии, стабилизатор мембран тучных клеток, блокирует выход гистамина. Длительная терапия препаратом улучшает работу бронхов, внешнюю дыхательную функцию, снижает частоту приступов удушья и кашля.

Показания: бронхиальная астма различного происхождения.

Противопоказания: повышенная чувствительность к компонентам препарата, детский возраст (до 2 лет), беременность на ранних стадиях.

Побочные действия: кашель, спазм бронхов, тошнота, желудочно-кишечные расстройства, головная боль, неприятный вкус во рту.

Способ применения: ингаляционно взрослым и детям старше 12 лет – по 2 дозы (4 мг) 2–4 раза в сутки; детям младше 12 лет – не более 10 мг в сутки (2–4 ингаляции).

Форма выпуска: аэрозоль для ингаляций, во флаконах – 56 или 112 доз (2 мг/доза).

Особые указания: терапия препаратом не должна прерываться, средство не используют для блокировки острого астматического приступа.

Лекция № 2

Тема: «Антисептические средства. Дезинфицирующие средства»

План:

1. Понятие об антисептическом и дезинфицирующем действии препаратов. Классификация антисептических средств по химической структуре.
2. Противомикробное действие препаратов хлора и йода. Применение в медицинской практике. Противопоказания к применению препаратов йода.
3. Характеристика фармакологических свойств соединений ароматического ряда. Местное и общее действие фенола. Применение.
4. Механизм противомикробного действия соединений алифатического ряда (спирт этиловый, формальдегид). Применение.
5. Общая характеристика красителей. Их действие. Показания к применению.
6. Фармакологические свойства окислителей (калия перманганат, перекись водорода). Механизм действия препаратов. Применение.
7. Производные нитрофурана: фурацилин. Спектр противомикробного действия. Влияние на грануляцию ткани. Применение.
8. Антисептическое действие кислот и оснований. Действие на кожу и слизистые оболочки. Применение препаратов борной кислоты и аммиака в качестве противомикробных средств.
9. Общая характеристика детергентов. Показания к применению.
10. Соли ртути. Показания к применению. Меры предосторожности при работе с препаратами ртути.
11. Общая характеристика препаратов серебра. Показания к применению.
12. Использование в медицинской практике препаратов цинка.
13. Острое отравление солями тяжелых металлов. Помощь при отравлении. Принципы действия унитиола при отравлении.

Для профилактики, лечения инфекционных болезней широко используются противомикробные средства, т.е. вещества, которые губительно действуют на микроорганизмы. Противомикробные вещества могут оказывать на микрофлору бактериостатическое действие (т.е. задерживают рост микроорганизмов) или бактерицидное действие (т.е. вызывают гибель микроорганизмов).

Определенные лекарственные средства используют для уничтожения микробов на предметах, инструментах и в окружающей среде – **дезинфекции**, или местно для обработки поверхности человеческого тела и его полостей – **антисептики**.

В соответствии с этим различают дезинфицирующие средства, применяемые для дезинфекции, и антисептики. Конечно, это разделение достаточно условно, так как многие вещества, известные как антисептики, можно использовать для дезинфекции предметов и инструментов и наоборот. Отдельные антисептики используют для воздействия на микроорганизмы, локализующиеся в желудочно-кишечном тракте и мочевыводящих путях.

Противомикробные средства делятся на:

I. **Антисептические** (анти – против, сепсис – гниение) – применяют для обеззараживания кожи, слизистых оболочек, ожоговых и раневых поверхностей, полостей тела. Эти же средства, используемые для дезинфекции одежды, предметов ухода за больными, выделений больных называют дезинфицирующими средствами.

Термин «дезинфекция» введен Р. Кохом.

II. **Химиотерапевтические средства** – применяют для воздействия на микроорганизмы, находящиеся в различных органах и тканях человеческого организма.

Основоположником учения антисептиков является ученый Листер. Впервые в 60-х годах XIX века применил карболовую кислоту в качестве обеззараживающего средства.

Классификация антисептиков.

1. Галогены.
2. Соединение ароматического ряда.
3. Соединения алифатического ряда.
4. Красители.
5. Окислители.
6. Производные нитрофурана.
7. Кислоты и щелочи.
8. Детергенты.
9. Соли тяжелых металлов.

I. Галогеносодержащие.

1. Хлорамин Б – Chloraminum B

содержит активный хлор, 1% - 2% дезинфекции предметов ухода за больными – 1-3 % растворы; для обработки рук – 0,25-0,5 %.

2. **Хлоргексидин** – применяют в растворах для обработки операционного поля и рук хирурга (0,5%), при раневых инфекциях, заболеваниях слизистой полости рта (0.05%).

3. **Натрия гипохлорид** – эффективен в отношении бактерий, грибов, вирусов. Сохраняет противомикробное действие в присутствии белковых веществ. Применяют для обработки кожи, слизистых оболочек, ран. Не следует допускать попадания в глаза.

4. **Раствор йода спиртовой 5 или 10% - solutio Jodi spirituosa** содержит активный йод. Применяется для обработки краев ран, царапин, ссадин. Оказывает сильное раздражение на кожу, может вызвать ожоги.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл. 5% раствора, склянки по 10-15-25 мл.

Йод входит в состав раствора **Люголя**. Применяется для смазывания слизистых оболочек при воспалительных заболеваниях зева, глотки.

Иодиол - Применяют наружно при гнойном отите (закапывают в ухо), при хроническом тонзиллите (промывают миндалины), при гнойных хирургических заболеваниях (накладывают повязки, смоченные иодиолом)

Иодонат –раздражающее действие на кожу оказывает в меньшей степени, применяют только для обеззараживания кожи операционного поля.

II. Соединения ароматического ряда

Фенол чистый Phenolum purum (кислота карболовая) – продукт перегонки каменного угля.

3-5% растворы применяют для дезинфекции помещений, предметов ухода, инструментов, белья, выделений больных и т.д.

На кожу и слизистые оказывают сильное раздражающее действие. Всасываясь в кожу, оказывает угнетающее действие на ЦНС (может появиться головокружение, угнетение дыхания, судороги). Поэтому, обращаться с фенолом надо с осторожностью.

Резорцин – применяют при бактериальных и грибковых поражениях кожи 2-5% растворы и 5-10% мази.

Деготь березовый – содержит фенол. Обладает антисептическим и инсектицидным действием (убивает насекомых). Деготь входит в состав мазей (мазь Вишневского), паст для лечения ран, пролежней, ожогов. Мазь Вилькинсона применяется для лечения чесотки.

III. Соединения алифатического ряда

Спирт этиловый Spiritus aethylicus

95-96% спирт этиловый вызывает денатурацию (свертывание) белков микроорганизмов. Применяется при обработке хирургических инструментов, игл, катетеров. На кожу оказывает сильное дубящее действие и применяется для дубления кожи рук хирургов.

Для обработки рук, в качестве антисептика, чаще используют 70%, т.к. он хорошо проникает в глубокие слои кожи и обработка рук достигает своей цели.

Раствор формальдегида губительно действует на бактерии, грибы, вирусы, оказывает дубящее действие на кожу и слизистые оболочки.

0,5% - 1% раствор применяется для дезинфекции белья, посуды, инструментов

IV Красители.

Наиболее чувствительны к ним грамположительные бактерии и кокки.

Бриллиантовый зеленый – Viride nitens: 1-2% водные и спиртовые растворы используются для обработки царапин, ссадин, для обработки операционного поля, при лечении пиодермии (гнойничковые заболевания кожи).

Этакридина лактам – Aethacridini lactas (риванол) менее активный. Водный 0,1% - 0,05% раствор применяется для промывания полостей (брюшной, грудной и т.д.), слизистых оболочек рта, зева и носа для обработки свежих инфицированных ран. Может применяться в виде клизм.

В дерматологии 2,5% присыпки; 1% мази; 5-10% пасты.

Форма выпуска – порошок.

Метиленовый синий – Methylenum coeruleum применяют наружно в качестве антисептика при ожогах, гнойничковых заболеваниях кожи – 1-3% спиртовые растворы. Для промывания мочеполовых путей – 0,02% - водные растворы.

Форма выпуска: порошок и ампулы.

V Окислители

Антисептическое действие проявляется за счет выделения атомарного или молекулярного кислорода.

Калия перманганат – Kalii permanganas. 0,01%-0,1% раствор (слабо-розовый) применяется для промывания ран, полоскания рта и горла, промывания мочевого пузыря, для промывания желудка при отравлениях.

2-5% растворы применяются для обработки ожогов, язв т.к. оказывает вяжущее и прижигающее действие.

Форма выпуска: порошок.

Перекись водорода – Hydrogenii peroxydi duluta – официальный 3% раствор.

Применяется для обработки загрязненных и гнойных ран. Применяется также как местное кровоостанавливающее средство (при носовых кровотечениях).

VI Производные нитрофурана

Имеют большую активность и малую токсичность.

Фурацилин – Furacilinum наружно применяют в виде 0,02% (1:5000) раствора для лечения гнойных ран, язв, ожогов, пролежней. Используют для промывания полостей тела (придаточных пазух носа, плевры и т.д.). Для полоскания рта и горла при стоматите, ангине.

Фурацилин способствует заживлению ран, для чего применяют 0,2% мази.

Форма выпуска: таблетки 0,02 для приготовления раствора (2 таблетки на 1 стакан воды).

VII Кислоты и щелочи

Оказывают противомикробное действие за счет гидролиза (расщепление) белков протоплазмы микроорганизмов.

Кислота борная – Acidum boricum – применяют 2-4 % растворы для полосканий при воспалительных заболеваниях слизистой оболочки рта, зева. 3% мази – для лечения кожных заболеваний.

Противопоказан детям раннего возраста, кормящим и беременным женщинам, при лечении заболеваний волосистых участков тела. Способен к кумуляции, в результате может вызывать поражение ЦНС.

Раствор аммиака (нашатырный спирт) – Solutio Ammonii caustici.

Официальный раствор - содержит 9,5 – 10,5% аммиака. Обладает выраженным антисептическим свойством, моющим свойством, т.к. растворяет жиры. Используют для мытья рук хирурга (25 мл на 5 л воды). Обладает раздражающим действием, это свойство используется для возбуждения дыхания при обмороке.

Форма выпуска: флаконы по 10, 40, 100 мл, ампулы по 1 мл.

VIII Детергенты – в переводе Detergere – очищать, имеют выраженное противомикробное и моющее действие.

1. Анионные детергенты. Это обычные мыла и мыло зеленое. Используют для мытья рук мед. персонала. Мыло зеленое входит в состав мази «Вилькинсона» для лечения кожных заболеваний.
2. Катионные детергенты. Более выраженные моющие средства и превосходят по противомикробной активности – препарат «Церигель», «Роккол» - используются для подготовки рук мед. персонала к операциям и манипуляциям, стерилизации инструментов, аппаратуры.

Миромастин – 0,01% раствор применяют для лечения инфицированных ран, ожогов, в стоматологической практике, при лечении инфекционных заболеваний ЛОР-органов, мочеполовой системы. Не следует допускать попадания в глаза.

IX Соли тяжелых металлов

Противомикробное действие оказывает в результате инактивации ферментов, необходимых для жизнедеятельности микроорганизмов. На кожу оказывают вяжущее, раздражающее или прижигающее действие, т.к. способны свертывать белки тканей.

Ртуты дихлорид – (сулема) – Hydrargyri dichloridum – оказывает сильное противомикробное и раздражающее действие. 0,1-0,2% (1:1000 – 1:500) растворы применяются для дезинфекции белья, предметов ухода и т.д.

Токсичен для человека: легко всасывается через кожу может вызвать тяжелые отравления. Обращаться с осторожностью.

Форма выпуска: таблетки по 0,5 и 1,0 для приготовления растворов.

Ртуты оксицианид – менее токсичное и менее активное средство.

1-2% раствор применяется для лечения конъюнктивитов и блефаритов (заболевание краев век).

Серебра нитрат – Argenti nitras (ляпис). Оказывает антисептическое и вяжущее действие. Применяют в виде 0,25%-2% растворов и 1-2% мазей для лечения воспалительных заболеваний глаз. В качестве прижигающего средства 5-10% растворы (для прижигания бородавок).

Протаргол – Protargolum – соединение серебра.

1-3% растворы применяют в качестве антисептического, вяжущего и противовоспалительного средства для промывания мочевого пузыря и уретры, лечения гнойных конъюнктивитов.

Цинка сульфат – Zinci sulfas

Применяется 0,25% раствор для лечения воспалительных заболеваний слизистых оболочек глаза, для промывания мочеиспускательного канала.

Ксероформ – соединение висмута, обладает вяжущим и слабым антисептическим действием. Входит в состав мази Вишневского.

Отравления солями тяжелых металлов

Наиболее токсичны препараты ртути (сулема). Острое отравление развивается после приема внутрь. Появляется жжение и боли в животе, тошнота, рвота, усиление слюноотделения.

Общее действие проявляется вначале возбуждением ЦНС (судороги), затем наступает угнетение ЦНС, нарушение сердечной деятельности – сердечная слабость, падение АД, слабый и частый пульс, нарушение функций почек. В результате выделения ионов ртути через слизистые желудочно-кишечного тракта развивается стоматит, язвенный колит, поражение почек.

Помощь: С целью предупреждения всасывания яда из желудочно-кишечного тракта дают молоко, яичный белок (связать ртуть белком) .

Осторожно промывают желудок с активированным углем. Внутрь активированный уголь и солевое слабительное. Введение антидотов (противоядий), в данном случае Унитиол(5% раствор в ампулах по 5 мл) - связывает ионы ртути. Симптоматическая терапия – анальгетики (морфин, промедол). При падении АД – эфедрин и др.

Лекция №3

Тема: «Химиотерапевтические средства. Антибиотики. Пенициллины.»

П Л А Н

1. Понятие о химиотерапевтических средствах.
2. Основные принципы химиотерапии.
3. Понятие об антибиотиках и антибиозе. Работы отечественных и зарубежных ученых в области открытия и внедрения в медицинскую практику антибиотиков. (Л. Пастер; И.И. Мечников; А. Флеминг; З.В. Ермолаева).
4. Классификация антибиотиков.
5. Понятие об основных и резервных антибиотиках.
6. Антибиотики группы пенициллина. Спектр противомикробного действия. Дозирование и пути введения препаратов. Показания к применению.
7. Особенности действия и применения полусинтетических пенициллинов.

Химиотерапевтические средства - средства, которые используются для воздействия на микроорганизмы, находящиеся в органах и тканях. В отличие от антисептиков химиотерапевтические средства менее токсичны для человека и обладают избирательностью действия на возбудителей заболевания.

➤ **К химиотерапевтическим средствам относятся:** антибиотики, сульфаниламидные средства, нитрофураны, оксихинолины и другие средства. Все химиотерапевтические средства оказывают действия не только на патогенную флору в организме, но влияют на обычную микрофлору кишечника, дыхательных путей, и на организм в целом, в результате чего может быть ряд нежелательных эффектов. Поэтому, приступая к химиотерапии надо соблюдать **основные принципы:**

1. Лечение проводить препаратом, к которому чувствителен возбудитель данного заболевания.
2. Как можно более раннее начало лечения заболевания.
3. Лечение проводить максимально допустимыми дозами, соблюдая интервалы между приемами препарата.
Достаточная длительность лечения.
4. При необходимости лечение должно проводиться комбинированно (в сочетании с другими препаратами) с целью повышения эффективности лечения и предупреждения развития устойчивой микрофлоры.
5. При необходимости проводить повторные курсы лечения для профилактики рецидивов болезни.

Антибиотики - это продукты (греч. - «анти» - против; «биос» - жизнь) деятельности микроорганизмов, которые разрушают другой живой организм.

Более 100 лет назад, в 1871 году, в печати появилась статья профессора Военно-медицинской академии В.А. Манасеина (Манассеин Вячеслав Авксентьевич), в которой рассказывалось о способности плесени убивать микробы.

Луи Пастер, наблюдавший борьбу между микробами, предсказывал использование этого явления с целью лечения больных.

В 1889 году француз Вюльмен собрал все сведения о взаимном влиянии микробов, сформировал очень важное положение: «Когда два живых тела соединяются, и одно из них оказывает разрушительное действие на другое, можно сказать, что происходит «Антибиоз» («анти» - против, «биос» - жизнь). От этого слова и произошло «Антибиотики» Явление антибиоза доказал в своих работах и русский микробиолог Мечников.

Классификация антибиотиков.

I. По химическому строению выделяют:

1. антибиотики, имеющие в структуре β -лактамное кольцо (β -лактамные антибиотики)
 - пенициллины;
 - цефалоспорины;
 - карбапенемы;
 - монобактамы.
2. макролиды (эритромицин и др.) и азалиды (азитромицин) - антибиотики, структура, которых включает макроциклическое кольцо.
3. тетрациклины - антибиотики, структурной основой которых являются четыре шестичленных цикла:
(тетрациклин и др.)
4. левомицетин
5. аминогликозиды - антибиотики, содержащие в молекуле аминсахара
 - стрептомицин
 - гентамицин и др.
6. антибиотики разных химических групп
 - полимиксин
 - клиндамицин
 - ванкомицин

II. По спектру противомикробного действия:

- а) действующие на грамположительную флору (пенициллины)
- б) действующие на грамотрицательную флору (полимиксины)

в) действующие на грамотрицательную и грамположительную флору (антибиотики широкого спектра действия).

III. По характеру противомикробного действия:

- **бактерицидные** - вызывают разрушение микроорганизмов (пенициллин, цефалоспорины, стрептомицин);
- **бактериостатические** - задерживают рост и размножение микроорганизмов - тетрациклин, левомицетин, эритромицин.

Кроме того антибиотики делят на: основные и резервные.

Основные - обладают наибольшей активностью при определенных инфекциях. **Резервные** - препараты, к которым микроорганизмы не выработали устойчивости. Препараты этой группы могут быть менее активны, либо дают более выраженные побочные эффекты, их отличает большая токсичность или быстрое развитие резистентности микроорганизмов, их назначают лишь при устойчивости микроорганизмов к основным антибиотикам или при непереносимости последних.

ПЕНИЦИЛЛИНЫ

Продуцируют пенициллины различные виды зеленой плесени. Пенициллин был открыт в 1928 году англичанином Александром Флемингом. В СССР в чистом виде выделен в 1942 году Е.В. Ермольевой и Т.И. Балезиной. (С 1942 года работали в Отделе биохимии микробов ВИЭМ, которым руководила З.В. Ермольева, где непосредственно участвовали в создании отечественного пенициллина.)

Пенициллины, которые являются продуцентами плесневых грибов, относятся к биосинтетическим пенициллинам. Кроме того, создан ряд полусинтетических пенициллинов.

Биосинтетические пенициллины

Действуют преимущественно на грамположительную флору (стафилококки не продуцирующие пенициллиназу, стрептококки, пневмококки), грамотрицательные кокки (менингококки, гонококки), возбудителя дифтерии, сибирской язвы, газовой гангрены и столбняка (клостридии), трепонемы. Не устойчивы к пенициллиназе, ферменту, который вырабатывается микроорганизмами.

1. Непродолжительного действия:

Бензилпенициллина натриевая соль

Бензилпенициллина калиевая соль

Benzylpenicillinum - natrium (kalium).

Действуют 3 - 4 часа, поэтому инъекции делают через каждые 3 - 4 часа.

Препарат особенно показан при острых бактериальных инфекциях: острых стрептококковых инфекциях, крупозной пневмонии, сибирской язве и др.

Натриевую соль можно вводить внутримышечно, внутривенно, под оболочки мозга. Калиевую соль вводят только внутримышечно.

Форма выпуска: флаконы с сухим порошком по 250 000 ЕД, 500 000 ЕД, 1 000 000 ЕД, перед применением разводят водой для инъекции, изотоническим раствором (0,9 %) NaCl, 0,25% - 0,5% раствором новокаина, из такого расчета, чтобы в 1 мл содержалось 100 000 ЕД антибиотика (правило 1:1)

2. Продолжительного действия

Бензилпенициллина прокаиновая соль (новокаиновая). Вводят только внутримышечно, длительность действия до 12 часов.

Применяют в основном при хронических бактериальных инфекциях.

Бициллин - 1 Bicillinum - 1 (бензатина бензилпенициллин), вводят внутримышечно, длительность действия 7-14 дней.

Bicillinum - 5. Длительность действия до 4-х недель. Вводят внутримышечно 1 раз в месяц.

Форма выпуска: флаконы по 1 500 000 ЕД

Бициллины применяют для лечения сифилиса и профилактики сезонных обострений, ревматизма.

Полусинтетические пенициллины

имеют более широкий спектр действия, устойчивы к действию кислой среды желудка.

Оксациллина натриевая соль - Oxacillinum-natrium. По спектру противомикробного действия сходен с бензилпенициллином, но в отличие от него устойчив к пенициллиназе. Основное назначение - стафилококковые инфекции, устойчивые к бензилпенициллинам.

Форма выпуска: таблетки, капсулы по 0,25, 0,5. Флаконы со стерильным порошком по 0,25 0,5, растворение как бензилпенициллина

(0,25 - 250 000 ЕД; 0,5 - 50 000 ЕД.) Вводят внутримышечно 4 - 6 раз в сутки.

Ampicillinum - имеет спектр противомикробного действия шире, чем у бензилпенициллинов, активен в отношении сальмонелл, шигелл, палочки протей и др. Разрушается пенициллиназой. Применяют при инфекциях мочевыводящих и

желчевыводящих путей, дыхательных путей, ЖКТ, в случае гнойной хирургической инфекции.

Форма выпуска: Ampicillini trihydras - таблетки, капсулы 0,25

Ampicillini natrium - флаконы по 0,25; 0,5 для в/м и в/в.

Амоксициллин. По активности и спектру действия аналогичен ампициллину. Назначают только внутрь. Очень активен при лечении инфекций ЛОР-органов, бронхов, мочевыводящих путей.

Комбинированные препараты уназин(ампициллин+сульбактам , амоксиклав - устойчивы к пенициллиназе.

В состав препарата **Амоксиклав** входят антибиотик амоксициллина тригидрат и калиевая соль клавулановой кислоты, которая является ингибитором ферментов (защищает антибиотик от пенициллиназы). Относится к фармакологической группе пенициллинов.

- Ф.В.Одна таблетка 375 мг содержит 250 мг амоксициллина и 125 мг клавулановой кислоты. В таблетке 625 мг содержится 500 мг амоксициллина, 125 мг клавулоновой кислоты.

Порошок для суспензии выпускается во флаконах из тёмного стекла, по одному в коробке. Там же находится мерная ложка. В состав обычной готовой суспензии входит 125 и 31,25 мг действующих веществ соответственно. При приготовлении суспензии "Амоксиклав Форте", в 5 мл её содержится вдвое большей действующих веществ – 250 и 62,5 мг Амоксиклав Квиктаб. Быстрорастворимые таблетки с фруктовым вкусом, содержащие либо 500 мг амоксициллина и 125 мг клавулановой кислоты, либо 875 мг амоксициллина и 125 мг клавулановой кислоты.

Аналоги :флемоклав, аугментин.

Флемоксин солютаб .Антибиотик группы пенициллинов широкого спектра действия, разрушающийся пенициллиназой

Препарат принимают внутрь. Препарат назначают до, во время или после приема пищи. Таблетку можно проглотить целиком, разделить на части или разжевать, запив стаканом воды, а также можно развести в воде с образованием сиропа (в 20 мл) или суспензии (в 100 мл), обладающих приятным фруктовым вкусом. Режим дозирования устанавливают индивидуально, с учетом тяжести течения заболевания, чувствительности возбудителя к препарату, возраста пациента.

Карбенициллина динамтриевая соль - не устойчив к кислоте(разрушается в желудке)по спектру действия сходен с ампициллином, но активно действует на все виды протей и синегнойную палочку, поэтому особенно показан при инфекциях,

вызванных синегнойной палочкой, протеем, кишечной палочкой (при пиелонефрите, пневмонии, перитоните и др.).

Форма выпуска: флаконы по 1,0

Токсичность пенициллинов низкая, но часто могут вызывать аллергические реакции, вплоть до анафилактического шока (падение АД, бронхоспазм, боль в животе, потеря сознания и др.). Лечение аллергических реакций: отмена препарата, введение антигистаминных средств.

При анафилактическом шоке - введение средств, повышающих АД, устраняющих бронхоспазм (адреналина гидрохлорид, эфедрина гидрохлорид, глюкокортикоиды). При приеме пенициллинов широкого спектра действия (особенно при приеме внутрь) может быть развитие дисбактериоза (чаще всего кандидамикоза).

Лекция №4

Цефалоспорины.

План:

1. Цефаломпорины характеристика.
2. Цефалоспорины первого поколения.
3. Цефалоспорины второго поколения
4. Цефалоспорины третьего поколения.
5. Цефалоспорины четвертого поколения.

Ц Е Ф А Л О С П О Р И Н Ы

Занимают первое место среди всех антимикробных средств по частоте применения у стационарных больных. По химическому строению сходны с пенициллинами, но устойчивы к пенициллиназе.

Имеют:

- широкий спектр действия;
- бактерицидный механизм действия;
- хорошую переносимость и небольшую частоту побочных эффектов.

Выделяют препараты I, II, III, IV поколений.

Цефалоспорины I поколения - цефазолин - , цефалексин - Активны преимущественно в отношении грамположительных кокков (стафилококков, стрептококков и др.) и некоторых грамотрицательных бактерий (кишечная палочка, протей и др.)

Все эти препараты не проникают в ЦНС. Терапевтическая концентрация в крови сохраняется 3-4 часа, поэтому обычно их вводят 4-6 раз в сутки. Цефалоспорины I поколения выводятся почками.

Нежелательные эффекты, характерные для этой генерации цефалоспоринов: аллергические реакции, тромбофлебиты и болезненность в месте инъекций. Больше проявляется у 1 и 2 поколения.

Цефазолин (кефзол). Обладает всеми свойствами цефалоспоринов I поколения. Вводят парентерально в сутки в 2- 3 приема.

Показания: 1) инфекции мягких тканей; 2) предоперационная профилактика при хирургических вмешательствах. Все другие показания к применению этого лекарства в настоящее время следует расценивать как недостаточно обоснованные.

Цефалексин (кефлекс). Применяется orally. Препарат не создает в крови высоких концентраций. Показания: 1) стрептококковые ангины; 2) инфекции кожи и мягких тканей.

Дозирование: по 0,5-1,0 г 4 раза в день (при ангинах возможно применение по 0,5 г 2 раза в день в течение 10 дней).

II поколение цефалоспоринов

Цефалоспорины II поколения - цефаклор - внутрь, **цефуроксим -** в/м. Обладают повышенной активностью в отношении менингококков, гонококков, гемофильной палочки. Применяется широко в клинической практике для лечения заболеваний различных локализаций. Препараты для приема внутрь являются оптимальными средствами в амбулаторной практике

Все эти препараты не проникают в ЦНС (единственным исключением из всей группы является цефуроксим, который применяют для лечения менингита). Терапевтическая концентрация в крови сохраняется 6-8 часов, поэтому обычно их вводят 3 раза в сутки. Цефалоспорины II поколения выводятся почками.

Нежелательные эффекты в основном такие же, как и при применении цефалоспоринов I поколения.

Цефаклор (верцеф, альфацет). Отличительной чертой этого препарата является активность в отношении возбудителей синуситов и отитов. Препарат хорошо проникает в ткани ЛОР-органов. Характерным нежелательным эффектом данного препарата являются нефротоксическое действие и гемолитическая анемия, которые иногда возникают у лиц, длительно принимающих этот антибиотик.

Показания: 1) инфекции нижних отделов дыхательных путей (в том числе пневмония, вызванная); 2) инфекции мочевыводящих органов; 3) инфекции мягких тканей; 4) лечение синуситов и отитов.

Дозирование: 0,5-1,0 г 2-4 раза в сутки.

Цефуроксим (кетоцеф, зиннат). - лактамаз-устойчивый препарат для лечения инфекций, вызванных грамотрицательными микроорганизмами. Хорошо проникает в ЦНС. Применяется парентерально (в виде натриевой соли) и orally. По сравнению с другими представителями этого поколения он более устойчив к действию лактамаз. Цефуроксима аксетил – пролекарство, которое подвергаясь ферментативному гидролизу в стенке кишечника выделяет активное основание цефуроксима.

Применение: 1) внебольничные пневмонии и инфекции нижних дыхательных путей; 2) инфекции урогенитального тракта и почек; 3) инфекции кожи и мягких тканей.

Способ применения и дозы:

В/в и в/м взрослым назначают по 750 мг 3 раза в сутки; при инфекциях тяжелого течения - дозу увеличивают до 1500 мг 3-4 раза в сутки (при необходимости интервал

между введениями может быть сокращен до 6 ч). Средняя суточная доза - 3-6 г. Детям назначают по 30-100 мг/кг/сут в 3-4 приема. При большинстве инфекций оптимальная доза составляет 60 мг/кг/сут. Новорожденным и детям до 3 мес назначают 30 мг/кг/сут в 2-3 приема.

III поколение цефалоспоринов

Цефалоспорины III поколения - *цефотаксим* - в\м, *цефиксим* - внутрь, *цефтриаксон* - в\м, *цефтазидим* - в\м. Имеют более высокую активность в отношении гонококков, менингококков, протей. Некоторые цефалоспорины III поколения активны в отношении синегнойной палочки. В отличие от цефалоспоринов I и II поколения проникают через гематоэнцефалический барьер и могут быть использованы для лечения инфекций ЦНС.

Цефалоспорины этого поколения еще более активны в отношении грам-отрицательной флоры, спектр их активности охватывает:

- грам-отрицательные и грам-положительные микроорганизмы чувствительные к предыдущим поколениям цефалоспоринов;
- возбудителей анаэробных клостридиальных и неклостридиальных (бактероиды, пептострептококки) инфекций;
- отдельные штаммы протей и синегнойной палочки;
- -лактамазопродуцирующие нейссерии. β-гемофильная палочка и

Все цефалоспорины III поколения хорошо проникают в ЦНС, элиминируются в равной мере печенью и почками.. Из-за их способности проникать в ЦНС они считаются препаратами выбора при лечении менингитов у детей. Терапевтическая концентрация в крови сохраняется около 12-24 часов, поэтому достаточно 1-2 введений препаратов в сутки.

Нежелательные эффекты: для цефалоспоринов этого поколения характерны все нежелательные эффекты, которые возникают при применении II поколения этих антибиотиков. Кроме того для препаратов III генерации возможно: 1) развитие нейротоксического эффекта – судорог 2) возникновение дисбактериоза, микозов и суперинфекций вследствие подавления нормальной микрофлоры (особенно выражено при пероральном назначении препаратов).

Цефотаксим (клафоран). Является препаратом первого ряда при лечении анаэробных инфекций, вызванных бактероидами (**Бактероиды**^[2] (лат. *Bacteroides*) — род грамотрицательных анаэробных палочковидных бактерий семейства *Bacteroidaceae.*), хорошо проникает во все ткани организма. Показания к применению: 1) инфекции мягких тканей 2) бактериальный менингит; 3) инфекции нижних отделов дыхательных путей (аспирационные пневмонии, абсцессы легких); 4) инфекции мочевыделительной системы. Дозирование: 1,0-2,0 г 2-4 раза в сутки в\м или в\в.

Цефтазидим (кефадим, фортум). Препарат высокоактивен в отношении инфекций, вызываемых синегнойной палочкой (антисинегнойный цефалоспорин). Выделяется

преимущественно почками. Показания к применению: те же, что и у цефотаксима, кроме того может применяться при сепсисе. Дозирование: 1,0 г 3 раза в сутки или 2,0 г 2 раза в сутки в/м или в/в.

Цефтриаксон (лонгацеф, роцефин). Этот препарат высокоактивен в отношении анаэробных бактериоидов, но большинство штаммов синегнойной палочки устойчивы к нему. Препарат длительно (более 24 часов) сохраняет терапевтическую концентрацию в организме после однократного введения, поэтому обычно он применяется только раз в день. Показания: таковы же как у цефотаксима.

Дозирование: 1,0-2,0-4,0 г 1 раз в день в/м или в/в.

ФВ: флаконы 0,25 и 1,0 с приложением растворителя – лидокаина.

Цефиксим(супракс) – внутрь

Ф.В.Капсулы содержимое капсул - смесь порошка и мелких гранул желтовато-белого цвета. 400 мг.

Гранулы для приготовления суспензии для приема внутрь от почти белого до кремового цвета, мелкие; готовая суспензия от почти белого до кремового цвета со сладким ароматом клубники. 5 мл готовой суспензии 100 мг

Показания

Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами:

- фарингит, тонзиллит, синусит;
- острый и хронический бронхит;
- средний отит;
- неосложненные инфекции мочевыводящих путей;
- неосложненная гонорея.

Противопоказания

- нарушение функции почек с КК менее 60 мл/мин (для капсул);
- детский возраст до 12 лет (для капсул);
- детский возраст до 6 мес (для суспензии);
- повышенная чувствительность к цефалоспорином и пенициллинам.

С *осторожностью* следует назначать препарат пациентам пожилого возраста, при хронической почечной недостаточности, псевдомембранозном колите (в анамнезе).

IV поколение цефалоспоринов

Все препараты этого поколения имеют примерно одинаковую фармакологическую характеристику. Для них характерен широкий спектр действия: к данному поколению чувствительны грам-положительные и грам-отрицательные кокки и бактерии, анаэробные бактериоиды, синегнойная палочка и протей. Все препараты этого поколения вводятся только парентерально.

Цефепим (максипим). Типичный представитель цефалоспоринов IV генерации. По ряду признаков приближается к карбапенемам

Показания:

- 1) инфекции нижних отделов дыхательных путей, мочеполовой системы, кожи и мягких тканей;
- 2) абдоминальные инфекции (к абдоминальным инфекциям относятся заболевания различной этиологии (чаще бактериальной), локализующиеся в брюшной полости и характеризующиеся ограниченным или распространенным процессом).

Дозирование: 1,0-2,0 г 2-3 раза в сутки в/м или в/в.

Нежелательные эффекты:

- 1) аллергические реакции;
- 2) флебиты и болезненность в месте инъекции;
- 3) дисбактериоз, микозы и суперинфекции, обусловленные подавлением нормальной микрофлоры организма;
- 4) нейротоксическое действие – судороги;
- 5) гепатотоксическое действие.

Противопоказания к цефалоспаринам. Повышенная чувствительность к препаратам, нарушение функции почек, печени. Побочное действие цефалоспоринов:

аллергические реакции. Возможна перекрестная сенсibilизация с пенициллинами. Может быть поражение почек.