

ЖИТОМИРСЬКИЙ БАЗОВИЙ ФАРМАЦЕВТИЧНИЙ ФАХОВИЙ КОЛЕДЖ

Лекція 7

Антибіотики різних груп

Луцак Ірина Василівна
канд.фарм.наук



АМФЕНІКОЛИ

Механізм дії:

незворотно пригнічують синтез білка мікробної клітини на рівні рибосом, порушують проникність цитоплазматичної мембрани, в результаті чого клітина втрачає іони K, амінокислоти, нуклеотиди.

Характер дії: бактеріостатичний, у ВД - бактерицидний.

Спектр дії – широкий: G⁻ (ентеробактерії, кишкова паличка, клебсієли, протей, гемофільна паличка, мораксели), деякі G⁺ бактерії, мікобактерії туберкульозу. Не впливають на анаероби.

ХЛОРАМФЕНІКОЛ

У зв'язку з високою токсичністю хлорамфенікол застосовують для лікування тяжких інфекцій, при яких менш токсичні антибактеріальні засоби неефективні або протипоказані.

Показання

Інфекційно-запальні захворювання, спричинені чутливими до препарату м/о: черевний тиф, паратифи, шигельоз, бруцельоз, сальмонельоз, ієрсиніоз, туляремія, гнійний перитоніт, бактеріальний менінгіт, рикетсіози, хламідіози, інфекції жовчовивідних шляхів.

Препарат показаний у випадках неефективності інших протимікробних засобів з огляду на можливість розвитку виражених побічних ефектів.

Найважчими побічними реакціями є апластична анемія, депресія кісткового мозку та «сірий синдром».



ХЛОРАМФЕНІКОЛ

Особливо небезпечний «сірий синдром», що спостерігається переважно у новонароджених (які народилися від матерів, яким застосовували хлорамфенікол під час пологів або у яких терапія хлорамфеніколом була розпочата в перші 48 год. життя), але при передозуванні можливий і у дітей старшого віку або в особливо чутливих людей (здуття живота, блювання, дихальний дистрес із тяжким метаболічним ацидозом, блакитно-сірий колір шкіри, зниження температури тіла, зниження нервових реакцій, пригнічення міокардіальної провідності, ССН, циркуляторний колапс, кома та летальний наслідок).

«Сірий синдром» також може спостерігатися внаслідок кумуляції препарату при відносному передозуванні (накопичення хлорамфеніколу, зумовлене незрілістю ферментів печінки, та його пряма токсична дія на міокард) у пацієнтів із порушенням функції печінки та нирок.

«Сірий синдром» проявляється при концентрації хлорамфеніколу в плазмі крові понад 50 мкг/мл.





Показання

Кон'юнктивіти, кератити, блефарити, викликані чутливими до препарату мікроорганізмами.

У разі супутнього застосування інших місцевих офтальмологічних препаратів слід дотримуватися інтервалу не менше 15 хв. між їх застосуванням.

Очні мазі застосовувати останніми.

Дорослим та дітям по 1 краплі в кожне око 3 р/добу.

Курс лікування 5–15 днів (залежить від характеру і вираженості захворювання, досягнутого терапевтичного ефекту).

Збільшені дози левоміцетину можуть призвести до тимчасового зниження гостроти зору.

Показання

Зовнішньо – при опіках, порізах, тріщинах шкіри, захворюваннях шкіри, що супроводжуються гнійно-запальним ураженням.

Протимікробний ефект зберігається протягом 6–12 год. Змащувати уражені ділянки шкіри (можна застосовувати під оклюзійну пов'язку).

Для лікування ран та опіків наносити на уражені ділянки шкіри 4–5 разів на добу.

АМІНОГЛІКОЗИДИ

Це антибіотики олігосахаридної природи, близькі за хімічною будовою, антимікробному спектру і фармакокінетичними характеристиками.

Назва обумовлена наявністю в їх молекулі аміноцукрів, які з'єднані глікозидним зв'язком.

Механізм дії:

незворотно пригнічують синтез білка мікробної клітини на рівні рибосом, порушують проникність цитоплазматичної мембрани, в результаті чого клітина втрачає іони K, амінокислоти, нуклеотиди.

Характер дії: бактерицидний.

Спектр дії – широкий: G⁻ (ентеробактерії, кишкова паличка, клебсієли, протей, гемофільна паличка, мораксели), деякі G⁺ бактерії, мікобактерії туберкульозу. Не впливають на анаероби.

Володіють постантибіотичним ефектом.

Їх активність порівняно невисока, резистентні штами дуже поширені, за тооксичністю незначно поступаються тетрациклінам (частота побічних ефектів до 40%).

Класифікація

I ПОКОЛІННЯ

Стрептоміцин

Неоміцин

Мономіцин

Канаміцин

Діють на мікобактерії туберкульозу (на відміну від II і III покоління), лепри, не впливають на синьо-гнійну паличку. Мають обмежене застосування через високу токсичність і появу резистентних штамів бактерій.

II ПОКОЛІННЯ

Гентаміцин (гараміцин)

Високоактивний по відношенню до золотистого стафілокока та синьо-гнійної палички.

III ПОКОЛІННЯ

Сизоміцин

Тобраміцин

Нетилміцин (нетроміцин)

Амікацин

Фраміцетин

Діють на м/о, які стійкі до препаратів I покоління та гентаміцину. Активні по відношенню до синьо-гнійної палички. Амікацин активний до мікобактерії туберкульозу.

Аміноглікозиди не всмоктуються в ШКТ, застосовуються в/м та в/в, не проникають через ГЕБ, слабо зв'язуються з білками крові. Стіійкість мікрофлори розвивається швидко.

За ступенем **зростання токсичності** можна розмістити:
сизоміцин < нетилміцин < гентаміцин < тобраміцин < амікацин < неоміцин < стрептоміцин < мономіцин < канаміцин.

По ступеню **зменшення антимікробної дії**:
амікацин > нетилміцин > сизоміцин > гентаміцин > амікацин > мономіцин > стрептоміцин > канаміцин.

Всі препарати проявляють дозозалежні побічні ефекти: виражену нефрота ототоксичність, при введенні у вену можуть проявляти нервово-мязову блокаду (курареподібну дію), еритематозне висипання, гарячку, диспепсію. Рідко викликають алергічні реакції.

Ототоксичність призводить до прогресивного пошкодження та руйнування сенсорних клітин у завитку та вестибулярному апараті вуха.

Результат є необоротним, може виявлятися у вигляді запаморочення, атаксії та втрати рівноваги в разі пошкодження вестибулярного апарату, а також порушення слуху або глухоти у разі кохлеарного ушкодження.

Будь-який аміноглікозид може спричинити обидва ефекти, але стрептоміцин та гентаміцин впливають на вестибулярну функцію, тоді як неоміцин та амікацин переважно впливають на слух. Ототоксичність посилюється при одночасному застосуванні інших ототоксичних препаратів.

Нефротоксичність полягає у пошкодженні ниркових каналців та може потребувати діалізу, хоча функція зазвичай відновлюється, якщо введення припиняються, як тільки токсичність для нирок.

Серйозна токсична реакція – **параліч, спричинений нервово-мязовий блокадою**, спостерігається лише якщо препарати вводять одночасно з нервово-мязовими блокаторами. Така реакція є наслідком інгібування поглинання Са необхідного для екзоцитотичного вивільнення ацетилхоліну.

Не можна призначати одночасно два аміноглікозида, або замінювати один іншим, якщо перший застосовувався протягом 7-10 днів. Протягом 2-3 тижнів після відміни не можна призначати інші ототоксичні препарати.

Дозування здійснюється у 2 режимах:

- *традиційне* – вводять 2-3 рази на добу або
- *однократне введення всієї ДД* – знижується ризик нефротоксичних ефектів при збереженні ефективності терапії.

Не призначаються у максимальних дозах людям похилого віку.
Курс лікування не більше 7-10 днів, в окремих випадках до 14 днів.

СТРЕПТОМІЦИН

Використовується здебільшого для лікування туберкульозу, інфекційно-запальних процесів різної локації, що спричинені Г+ та Г- м/о, чутливими до препарату: при пневмонії, спричиненій клебсієлами, при ендокардиті, чумі, туляремії, бруцельозі.

До нього швидко розвивається звикання.

Властива висока ото- і нефротоксичність, схильний до кумуляції.



НЕОМІЦИН

Найтоксичніший аміноглікозид, не призначається дітям. Застосовується для стерилізації кишечника перед операціями на товстому кишечнику разом з еритроміцином, місцево- для лікування ран та в очній практиці.



неоміцину сульфат+
поліміксину В сульфат+
дексаметазон



Місцеве лікування зовнішніх отитів бактеріального походження без ушкодження барабанної перетинки, зокрема інфекційної екземи зовнішнього слухового проходу.

Запально-інфекційні захворювання носової порожнини, у т. ч. гострий риніт, гострий синусит.
Дорослим по 1 вприскуванню 3-5 р/добу,
дітям віком від 15 років – по 1 вприскуванню 3 р/добу у кожен носовий хід.
Середня тривалість лікування – 5 днів.



неоміцину сульфат+ поліміксину В сульфат+ дексаметазон



Запалення тканин ока, при яких показано застосування ГКС та існує поверхнева бактеріальна інфекція або ризик її розвитку.

При легких формах захворювання закапувати 1–2 кр. у кон'юнктивальний мішок (-ки) ураженого ока (очей) до 4–6 р/день.

При тяжких захворюваннях закапувати 1–2 кр. щогодини, поступово зменшуючи частоту застосування до повного припинення в міру послаблення запалення.

Після інстиляції рекомендується щільне закриття повік або нососльозова оклюзія. Це знижує системну абсорбцію ліків, введених в око, що зменшує вірогідність системних побічних ефектів.



бацитрацин цинку +
неоміцину сульфат

Показання

Бактеріальні інфекції обмежених ділянок шкіри:
бактеріально інфікований простий герпес,
оперізувальний герпес/вітряна віспа;
контагіозне імпетиго;
інфіковані варикозні виразки;
інфікована екзема; бактеріально інфікований
пелюшковий дерматит.



+ Профілактика
пупкової інфекції у
новонароджених.

МОНОМІЦИН

Через виражену токсичність застосовують лише для лікування лейшманіозу (на відміну від інших аміноглікозидів діє на найпростіші).

КАНАМІЦИН

Серед препаратів I покоління володіє найбільшою бактерицидною активністю, високою ото- і нефротоксичністю.

Є препаратом резерву при туберкульозі (штамах стійких до стрептоміцину), може використовуватися при кишкових інфекціях і для санації кишківника перед операціями на ШКТ, тяжких гнійно-септичних захворювань (сепсис, менінгіт, перитоніт, септичний ендокардит).

Ефективний відносно м/о, резистентних до тетрацикліну, еритроміцину, левоміцетину.

Не діє на анаеробні м/о, дріжджі, віруси та більшість найпростіших.



ГЕНТАМІЦИН (гараміцин)

є антибіотиком групи аміноглікозидів з широким спектром дії.

Активний по відношенню до синьо-гнійної палички, добре проникає в кістки, бронхи, легені, простату.

Схильний до кумуляції. Є препаратом резерву.

Доцільно призначати при важких інфекціях, викликаних стафілококами та Г- флорою. Не активний по відношенню до мікобактерій туберкульозу. Токсичніший ніж канаміцин.

Не метаболізується в організмі. Виводиться у незміненому вигляді з сечею. Його слід застосовувати у тих випадках, коли м/о резистентні до більш безпечних антибіотиків.



Показання: бактеріальні інфекції, спричинені чутливою до гентаміцину мікрофлорою, зокрема:

- інфекції нижніх відділів дихальних шляхів,
- ускладнені уrogenітальні інфекції,
- інфекції кісток та суглобів, зокрема остеомієліт,
- інфекції шкіри та м'яких тканин,
- інфіковані опікові рани,
- абдомінальні інфекції (перитоніт),
- інфекції центральної нервової системи, зокрема менінгіт у комбінації з β -лактамними антибіотиками,
- септицемія





Дерматози, які піддаються лікуванню ГКС, при ускладненні або при підозрі на ускладнення вторинною інфекцією, викликаною чутливими до гентаміцину м/о: екзема (атопічна, дитяча, монетоподібна), аногенітальний та старечий свербіж, контактний дерматит, себорейний дерматит, нейродерміт, інтертригінозний дерматит, сонячний дерматит, ексфоліативний дерматит, стаз-дерматит та псоріаз.

Не рекомендується застосування крему під оклюзійні пов'язки.

ГЕНТАСЕПТ

У серпні 2016 р. ПАТ НВЦ «Борщатівський ХФЗ» змінює назву лікарського засобу «ГЕНТАКСАН» на «ГЕНТАСЕПТ»!



комбінований антимікробний препарат пролонгованої дії для місцевого застосування, містить гентаміцину сульфат, кремній-органічний сорбент – поліметилсилоксан (метоксан) і сполуку цинку з триптофаном.

Показаний для лікування інфікованих ран, викликаних чутливими м/о. Застосовувати місцево протягом усього часу лікування ран до їх повного загоєння.

КРЕМГЕН

Комбінований препарат для зовнішнього застосування, що містить ГКС флуоцинонід та гентаміцин.



Показаний для лікування запальних та алергічних захворювань шкіри, у т.ч. ускладнені вторинною бактеріальною інфекцією:

екзема різних форм та локалізації, дерматит, псоріаз, старечий свербіж, червоний плескатий лишай, трофічні виразки (окрім виразок гомілки, що пов'язані з варикозним розширенням вен), опіки та обморожування шкіри I ступеня, укуси комах та членистоногих.

Препарат наносити тонким шаром на уражені ділянки шкіри 2-3 рази на добу.

Бажано застосовувати короткими курсами (не довше 10 днів), на невеликі ділянки шкіри.

АМІКАЦИН

Найсильніший препарати групи. активний по відношенню до багатьох госпітальних штамів Г- бактерій (в т.ч. синьо-гнійної палички), мікобактерії туберкульозу і штамів резистентних до гентаміцину, не діє на ентерококи.

Менш нефротоксичний, але більш ототоксичний ніж гентаміцин.



ТОБРАМІЦИН (бруламіцин)

Діє бактериостатично. Менш нефротоксичний, ніж гентаміцин і активніший за нього в 2-4 рази по відношенню синьо-гнійної палички.



- інфекційні захворювання ЦНС, в т. ч. менінгіт, септицемія та сепсис новонароджених;
- черевної порожнини, в т. ч. перитоніт,
- тяжкі стафілококові інфекції, у випадках, коли пацієнту протипоказані пеніцилін та інші препарати з нижчим ризиком токсичності.

Лікування хронічної легеневої інфекції, спричиненої *Pseudomonas aeruginosa*, у хворих на муковісцидоз.

ТОБРАМІЦИН



Показання.

Лікування зовнішніх інфекцій ока та прилеглих тканин, викликаних чутливими до тобраміцину патогенними м/о.

При легкому та середньої тяжкості перебігу захворювання закапувати по 1–2 кр. у кон'юнктивальний мішок (-ки) ураженого ока (очей) кожні 4 год.

При тяжкому перебігу захворювання закапувати по 1–2 кр. у кон'юнктивальний мішок (-ки) ураженого ока (очей) кожну годину до поліпшення стану; частоту застосування препарату слід поступово зменшувати до повного припинення.

Найпоширенішими побічними реакціями є гіперемія очей та відчуття дискомфорту в очах.

тобраміцин+дексаметазон



Заст. смужка
довжиною 1,5 см 2-3
р/добу

Показання

Запалення очей у пацієнтів, чутливих до стероїдів, при яких показане застосування кортикостероїдів та існує поверхнева бактеріальна інфекція або ризик розвитку бактеріальної інфекції ока. Ці запальні процеси можуть виникнути після хірургічного втручання (видалення катаракти) або можуть бути спричинені інфекцією, потраплянням в око стороннього тіла або очною травмою.

Вміст бензалконію хлориду може спричинити подразнення ока і знебарвлювати м'які контактні лінзи, тому слід уникати контакту з ними. У разі, якщо пацієнту дозволено носити контактні лінзи, його слід попередити про те, що необхідно знімати контактні лінзи перед застосуванням очних крапель і зачекати щонайменше 15 хв., перш ніж знову їх одягнути.

СИЗОМІЦИН

Найактивніший препарат серед III покоління по відношенню до протей, синьо-гнійної палички, ентеробактерій і клебсієл. Спостерігається перехресна стійкість м/о до сизоміцину, гентаміцину і тобраміцину.

Не кумулює.

Призначають при важких Гр (-) інфекціях.

НЕТИЛМІЦИН

Активний по відношенню госпітальних Гр(-) бактерій, резистентних до гентаміцину, краще проникає через ГЕБ, дещо менш ото- і нефротоксичний.

ФРАМІЦЕТИН

антибіотик з групи аміноглікозидів для місцевого застосування. Концентрація фраміцетину, яка досягається при місцевому застосуванні, забезпечує його бактерицидну активність по відношенню до Г+ та Г- м/о, які спричиняють розвиток інфекційних процесів у ВДШ.

Застосовується в ЛОР практиці місцево (інтраназально).

Стійкість м/о до нього розвивається повільно.



У складі комбінованої терапії при ринітаз, ринофарингітах, синуситах при відсутності ушкодження стінок пазухи носа; профілактика та лікування запальних процесів після операційних втручань.

Не слід застосовувати для промивання придаткових пазух носа. При тривалому застосуванні можливе виникнення резистентних штамів м/о.

Дорослим по 1 впорскуванню у кожен носовий хід 4-6 р/добу.

Дітям віком від 1 року по 1 впорскуванню у кожен носовий хід 3 р/добу.

Якщо протягом 7 днів лікування терапевтичний ефект відсутній, препарат потрібно відмінити.

ТЕТРАЦИКЛІНИ

Природні і напівсинтетичні антибіотики, в основі молекули яких знаходиться 4 конденсовані 6-членні кільця.

Механізм дії: пригнічення синтезу білка мікробної клітини на рівні рибосом, незворотно зв'язують метали, утворюючи з ними хелатні сполуки та інгібуючи ферментні системи.

Характер дії: бактеріостатичний.

Спектр дії – широкий, Г+, Г-, високоактивні до внутрішньоклітинних м/о, найпростіших, однак властивий високий рівень вторинної резистентності багатьох бактерій.

Перехресна чутливість м/о до всіх препаратів групи тетрацикліну.

Курс лікування, як правило, 5-7 днів.

Рекомендовано приймати стоячи для профілактики виразкоутворення стравоходу і подразнення слизової оболонки ШКТ, запиваючи 200 мл води.

Після лікування препаратами групи протягом 4-5 днів слід уникати прямого потрапляння УФ-випромінювання.

Можлива токсичність:

- ентеротоксичність, диспепсія, ерозії стравоходу,
- гепатотоксичність, нефротоксичність, дисбактеріоз,
- суперінфекція,
- дисколорація зубів у дітей, дефекти емалі,
- ↑ ВЧТ при тривалому вживанні,
- фотодерматит,
- алергічні реакції,
- порушення білкового обміну.

N.b.! Категорично протипоказані при вагітності та у педіатрії.

Не застосовують одночасно з:

- макролідами, стрептоміцином, пеніциліном;
- молочними продуктами, антацидами, препаратами заліза, кальцію, магнію (утворюють нерозчинні хелатні сполуки),
- циклоспорином, вітаміном С, антикоагулянтами,
- препаратами, що містять дигідровані алкалоїди ріжків.

Всмоктування більшості препаратів є нерегулярним і неповним, але покращується за відсутності їжі.

Оскільки тетрацикліни хелатують іони металів (кальцію, магнію, заліза, алюмінію), утворюючи комплекси, що не всмоктуються, абсорбція зменшується за наявності молока, деяких антацидів і препаратів заліза.

Найпоширенішими **побічними ефектами** є *порушення функцій ШКТ*, спричинені спочатку безпосереднім подразненням, а пізніше – модифікацією кишкової флори.

Може виникнути *дефіцит вітаміну В*, а також суперінфекція.

Оскільки вони хелатують Са, тетрацикліни осідають у кістках, які ростуть і зубах, зумовлюючи *фарбування, а іноді гіпоплазію зубів та деформацію кісток*. Тому їх не можна призначати дітям, вагітним та матерям, які годують груддю.

Гепатотоксичність (особливо небезпечна для вагітних).

Фототоксичність – сенсibilізація до сонячного світла.

ВД зменшують синтез білка в клітинах-хазяїна (антианаболічна дія) – пошкодження нирок.

Класифікація	
природні	
Тетрациклін Окситетрациклін	короткої дії (6-8 год) 4 рази на добу
напівсинтетичні	
Доксициклін Метациклін Міноциклін	тривалої дії (12-24 год) 1-2 рази на добу
комбіновані	
для зовнішнього застосування	для внутрішнього застосування
гіоксизон (окситетрациклін + гідрокортизон) полькортолон (тетрациклін + триамцинолон)	олететрин (тетрациклін + олеандоміцин)

ТЕТРАЦИКЛІНУ ГІДРОХЛОРИД

Еталонний представник групи, широкого спектра дії.

Активний відносно Г+ (стафілококів, у т.ч. до тих, що продукують пеніциліназу; стрептококів, пневмококів, клостридій, лістерій, палички сибірської виразки) і Г- бактерій (гонококів, бордетел, кишкової палички, ентеробактерій, клебсієл, сальмонел, шигел), а також спірохет, рикетсій, лептоспір, збудників трахоми, орнітозу.

Малоактивний або неактивний щодо синьогнійної палички, протею, серації, кислотостійких бактерій, більшості штамів виду *Bacteroides fragilis*, грибів, вірусів грипу, поліомієліту, кору.

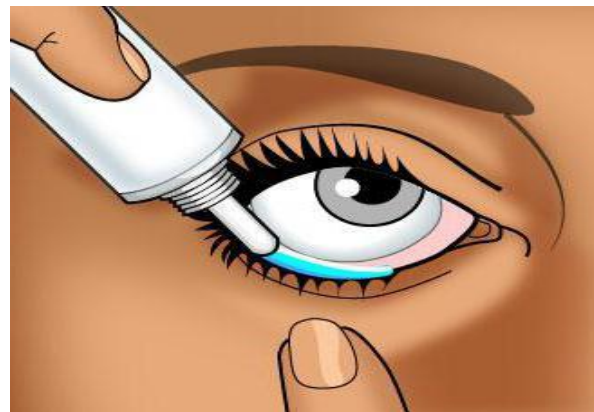
Є дані про ефективність тетрацикліну при захворюванні на холеру.



У формі очної мазі застосовують для лікування блефариту, кон'юнктивіту, кератиту, дакриїциститу, ячменю, трахоми, а також у складі до- та післяопераційної профілактики в очній хірургії.

Препарат також застосовують для профілактики бленореї новонароджених (*Neisseria gonorrhoeae*).

При місцевому офтальмологічному застосуванні тетрацикліну слід мати на увазі, що його бактеріостатична дія може перешкоджати бактерицидній дії пеніцилінів, цефалоспоринів та аміноглікозидів. Слід уникати їх одночасного застосування, як місцевого, так і системного.



ДОКСИЦИКЛІН

Легше і краще всмоктується, ніж інші тетрацикліни, краще проникає в тканини.

Частота побічних ефектів рідша, ніж при лікуванні іншими препаратами, менш нефротоксичний.

Може кумулювати в організмі, зв'язування з білками становить 80-90%.

Накопичується в жовчі, легенях, додаткових пазухах носа, нирках.

Призначають 1 раз на добу, можна пацієнтам з нирковою недостатністю (виведення відбувається головним чином у формі мікробіологічно активної речовини через кишечник).



МІНОЦИКЛІН

Препарат пролонгованої дії, за силою перевершує інші представники.
Відсутня перехресна стійкість м/о з іншими тетрациклінами.
Краще проникає в шкіру, м'язи та ГЕБ.
Є препаратом першого ряду при лікуванні інфекцій шкіри.
Кумулює в організмі.
В перші дні прийому може спостерігатися вестибулярні розлади (частота 80-90%).



ЛІНКОЗАМІДИ

Особливості групи:

- Перехресна стійкість мікрофлори до обох препаратів
- Високі концентрації в кістках і суглобах;
- Погане проникнення через ГЕБ;
- Відсутність перехресної алергії з β -лактами;
- Відносно частий розвиток антибіотикоасоційованої (C.difficile-асоційованої) діареї.

Механізм дії: інгібують синтез білка в бактеріальній клітині.

Характер дії: бактеріостатичний;

на стрептококи і анаероби – бактерицидний.

Спектр дії – вузький: Г+ коки та анаероби, внутрішньоклітинні збудники.

ЛІНКОМІЦИН

Малотоксичний навіть для новонароджених.

Показаний при септичному стані, застосовують в стоматології.

Стійкість до нього розвивається повільно.

Біодоступність 25-40%.

Всмоктування залежить від прийому їжі, тому призначають за 2 год до прийому або через 2-3 після вживання їжі.

При швидкому в/в введенні високих доз може бути колаптоїдний стан та псевдомембранозний коліт.

Проявляє антагонізм до макролідів.



КЛІНДАМІЦИН

Похідне лінкоміцину, порівняно з ним наділений в 4-8 разів більшою активністю по відношенню до анаеробів та в 2-5 разів до інших м/о, добре всмоктується.

Швидко досягає високих концентрацій в крові, краще проникає в порожнини абсцесів.

Досить токсичний: викликає псевдомембранозний коліт (20%), гепато-, нефро-, гематотоксичний, нейро-мязовий блок, зупинка дихання.



ГЛІКОПЕПТИДИ

Особливості:

- антибіотики резерву при лікуванні госпітальних інфекцій
- високоактивні відносно ентерококів
- можлива ототоксичність (у людей похилого віку), нефротоксичність, флебіти, синдром «червоної людини» при швидкому введенні, гіпотензія, гарячка, свербіння, бронхоспазм.
- підвищують ризик грибової суперінфекції

Механізм дії: пригнічують синтез пептидоглікану клітинної стінки бактерій

Характер дії: бактерицидний.

Спектр дії – вузький: Гр(+) коки – золотистий та епідермальний стафілококи, стрептококи, пневмококи, клостридії, лістерії, неспороутворюючі анаероби.

ВАНКОМІЦИН

Ефективний переважно проти Г+ бактерій, стафілококових інфекціях, у пацієнтів з алергією до пеніцилінів і цефалоспоринів. Не всмоктується в кишківнику.

Може використовуватися в педіатрії при важких інфекціях, стійкість м/о до нього практично не розвивається.

Швидке введення препарату у формі болюсної ін'єкції (протягом кількох хвилин) може спричинити значну артеріальну гіпотензію, включаючи шок, зрідка із зупинкою серця, тому для зменшення ризику розвитку гіпотензивних реакцій слід контролювати АТ пацієнта під час введення ЛЗ.

Слід застосовувати тільки в/в через небезпеку розвитку некрозу м'яких тканин



ТЕЙКОПЛАНІН

Більш активний ніж попередній препарат, тривалішої дії, застосовується 1 раз на добу.

Наділений меншою токсичністю ніж ванкоміцин.

Найбільшу активність проявляє по відношенню до золотистого стафілокока.



ДАПТОМІЦИН

натуральний продукт класу циклічних ліпопептидів, що проявляє активність лише щодо Г+ бактерій.

Механізм дії: зв'язується (у присутності іонів кальцію) з клітинними мембранами бактерій та спричиняє швидку деполяризацію мембранного потенціалу клітин як у фазі росту, так і в стаціонарній фазі. Ця втрата мембранного потенціалу спричиняє інгібіцію протеїну, ДНК та синтезу РНК, внаслідок чого гине бактеріальна клітина з її незначним лізисом.



РИФАМІЦИНИ

РИФАМПІЦИН



Антибіотик бактерицидної дії, який найчастіше застосовується при лікуванні туберкульозу.

Добре діє на Гр(+) флору, збудника лепри, помірно на легіонелу. Є одним із кращих антистафілококових препаратів.

Механізм дії: пригнічує початкову реакцію зчитування коду ДНК в мікробній клітині. Збільшує кількість гепатоцитів, які виробляють ферменти, що метаболізують цілий ряд засобів (прискорюється метаболізм естрогенів, ГКС, СГ, антикоагулянтів).

Забарвлює сечу, слюзи, харкотиння хворих у оранжево-червоний колір.

Швидко розвивається стійкість мікрофлори. Препарат нефро-, гепатотоксичний, викликає грипоподібний синдром, тромбоцитопенію, алергічні реакції, диспептичні явища.



- загострення хронічного середнього отиту (у т.ч. при наявності стійкої перфорації барабанної перетинки);
- ізольовані гнійні ураження барабанної перетинки;
- стан після оперативного втручання на середньому вусі.

РИФАБУТИН

Напівсинтетичний антибіотик, по активності перевершує рифампіцин.

Механізм дії: інгібує синтез РНК, вибірково зв'язуючись з ДНК-залежною РНК-полімеразою.

Варто дотримуватися обережності при призначенні препарату з макролідами, протигрибковими засобами з групи азолів.

ФОСФОМІЦИНИ

ФОСФОМІЦИН

Володіє широким спектром бактерицидної дії (на Гр(-) м/о).

Ефективний щодо штамів збудників інфекцій сечовивідних шляхів, які найчастіше виділяються (*E. coli*, *Citrobacter spp.*, *Klebsiella spp.*, *Proteus spp.*, *Serratia spp.*, *P. aeruginosa* та *Enterococcus faecalis*), навіть якщо вони стійкі до інших антибактеріальних засобів.

Діє також на пеніциліназоутворюючі штами.

Фосфоміцин чинить антиадгезивну дію на бактерії, що мають властивість адгезії до епітелію, який вистилає сечовивідні шляхи.

резистентність до нього розвивається повільно.

Забарвлює сечу і слину в оранжевий колір.



Показання:

- лікування гострих неускладнених інфекцій нижніх сечовивідних шляхів, спричинених чутливими до фосфоміцину м/о, у чоловіків, у дівчат віком від 12 років та жінок;
- профілактика під час діагностичних процедур та хірургічних втручань у дорослих пацієнтів.

Приймати слід натще за 2 год до їди, бажано ввечері після випорожнення сечового міхура і не вживати їжу протягом наступних 2 год.

Побічні реакції при одноразовому прийомі можливі з боку травного тракту, в основному діарея. Ці явища зазвичай нетривалі і проходять самостійно.



ФУЗИДИНИ

ФУЗИДОВА КИСЛОТА

Стероїдний антибіотик вузького спектру дії, активний до Г+ м/о.

Механізм дії: зворотно зв'язується з 50S-субодиницею рибосом і порушує синтез білка в мікробній клітині.

Належить до резервних антистафілококових препаратів. До них швидко розвивається резистентність (у випадку монотерапії).

Натрієва сіль застосовується всередину, диетиламінова сіль – в/в.

Призначають у поєднанні з іншими антистафілококовими засобами при сепсисі і місцево при стафілококових інфекціях (очні краплі, мазь, крем).



Гель необхідно наносити дорослим та дітям віком від 1 місяця тонким шаром на уражені ділянки шкіри 2-3 рідобу протягом 7 діб.
Лікування вугрів необхідно проводити протягом 14 днів.
Можна застосовувати гель під пов'язку – 1-2 рази на добу.
При наявності некротичних мас, перед застосуванням препарату їх необхідно видалити.



Лікування екзематозних дерматозів при наявності бактеріальної інфекції або при високій її імовірності.

Через ризик пригнічення адренокортикальної функції слід уникати безперервного лікування довше 7 днів у дітей віком до 4 років. Дорослим не рекомендується застосовувати препарат довше 2 тижнів.

ПОЛІМІКСИНИ

Поліпептидні антибіотики, які складаються з різних амінокислот.

Володіють вузьким спектром дії, високою токсичністю, не всмоктуються в ШКТ.

Поліміксини діють вибірково на аеробні Г- бактерії, які мають гідрофобну зовнішню мембрану, підвищують проникність клітинної мембрани бактерій.

Застосовуються лише по життєвим показникам.

Стійкість до поліміксинів виробляється дуже повільно.

ПОЛІМІКСИНУ М СУЛЬФАТ

Через токсичність застосовується лише всередину і місцево, його поєднують з антибіотиками, які діють на Гр(+) м/о.

ПОЛІМІКСИНУ В СУЛЬФАТ

Не всмоктується в ШКТ, використовують парентерально. Чинить бактерицидну дію проти майже всіх грамнегативних бактерій, за винятком групи *Proteus*.

Всі Г+ бактерії, гриби та Г- коки, *N. gonorrhoeae* і *N.meningitidis* є резистентним до поліміксину В.

Менш токсичний, застосовується парентерально, здебільшого при синьо-гнійній інфекції.

Є препаратом вибору при лікуванні інфекцій сечовивідних шляхів, оболонки головного мозку та бактеріємії, що викликані чутливими штамми *Pseudomonas aeruginosa*.

Необхідно уникати одночасного застосування поліміксинів із м'язовими релаксантами (курареподібними) та іншими нейротоксичними препаратами, такими як ефір, тубокурарин, сукцинілхолін, галамін, декаметоній і цитрат натрію, оскільки ці агенти можуть викликати розвиток нервово-м'язової блокади.

КОЛІСТИН

циклічний поліпептидний антибактеріальний засіб групи поліміксинів.

Показання

В/в застосування показане дорослим і дітям (новонародженим), для лікування тяжких інфекцій, викликаних окремими аеробними Г-патогенами, у пацієнтів з обмеженими варіантами лікування.

У вигляді інгаляцій також показаний дорослим і дітям з муковісцидозом для лікування хронічних легеневих інфекцій, викликаних *Pseudomonas aeruginosa*.



БАЦИТРАЦИН

Поліпептидний антибіотик.

Механізм дії: впливає на рибосоми м/о з утворенням аномальних білків, що незворотно інгібує життєдіяльність мікробних клітин і приводить до їхньої загибелі (бактерицидна дія).

Ефективний відносно багатьох аеробних Г+ (гемолітичний стрептокок, стафілокок) і деяких Г- бактерій (нейсерія, гемофільна паличка).

Має постантибіотичний ефект.

Не слід призначати системно.

Застосування. Профілактика інфекційно-запальних ускладнень при незначних травмах, порізах шкірних покривів, пошкрябинах та опіках.

ГОМОПЕПТИДНІ АНТИБІОТИКИ

ГРАМІЦИДИН

активний по відношенню Гр(+) коків (стафіло-, пневмо-, стрептококи) та анаеробів, володіє сперміцидною дією.

Застосовується тільки місцево.

Стійкість до них відсутня.

Зменшує ефекти інших антибактеріальних засобів.

Антибактеріальна активність не знижується в присутності гною.



ГОМОПЕПТИДНІ АНТИБІОТИКИ

ТИРОТРИЦИН

є сполукою різних циклічних і лінійних поліпептидів, які виявляють антибактеріальну активність, і утворюється як ендотоксин анаеробними спороутворюючими *Bacillus brevis*. Ця сполука містить до 70–80 % тироцидинів (основних циклічних декапептидів) і до 20–30 % граміцидинів (нейтральних лінійних пентадекапептидів).



Прискорює процес загоєння ран шляхом очищення дна рани, а також стимулюванням процесів грануляції та епітелізації.

Місцеве лікування рваних ран, подряпин, саден.





містить комбінацію речовин (тиротрицин, лідокаїну гідрохлорид моногідрат, хлоргексидину диглюконат), що мають протимікробні властивості та чинять місцевоанестезуючу дію.

Показання: запальні та інфекційні захворювання порожнини рота та глотки (стоматити, гінгівіти, пародонтити, глосити, тонзиліти, фарингіти та інші стани, що супроводжуються порушенням ковтання).

Для профілактики інфекцій перед та після хірургічного втручання у ділянки порожнини рота та глотки.

Поєднує у своєму складі речовини протизапальної, анальгетичної, антибактеріальної та антисептичної дії, що виявляють взаємодоповнюючий і синергічний вплив.

Показання: місцеве лікування при інфекційно-запальних захворюваннях порожнини рота та верхніх дихальних шляхів: тонзиліт, фарингіт, ларингіт, афтозний та виразковий стоматит, глосит.



ОКСАЗОЛІДИНОНИ

новий клас синтетичних антибактеріальних препаратів з переважною активністю проти Гр(+) м/о, в т.ч. стійкими до всіх інших груп антибіотиків і синтетичних ХТЗ.

механізм дії - інгібітори білкового синтезу бактеріальної клітини, незворотно зв'язуються з 30S і 50S-субодинами рибосоми і порушують утворення 70S – функціональних ініціюючих комплексів пептидного ланцюга.

ЛІНЕЗОЛІД

За спектром дії активний проти широкого спектру Г+ м/о, MRSA, пеніцилін-резистентного стрептококу, резистентні до ванкоміцину ентерококи, анаероби (клостридії).

Володіє доброю фармакокінетикою: швидко і практично повністю всмоктується із кишечника (біодоступність близько 100 %), проявляє кращу тканинну біодоступність у порівнянні з ванкоміцином.

Володіє постантибіотичним ефектом.

Показання тяжкі інфекції, що викликаються Гр+ м/о (пневмонії, сепсис, інфекції шкіри, м'яких тканин)

Стійкість до лінезоліду в процесі лікування розвивається рідко і тільки у випадку тривалого застосування у великих дозах.

Являється неселективним інгібітором MAO.



ДІОКСИДИН

антибактеріальний препарат широкого спектра дії.

Ефективний при інфекціях, спричинених вульгарним протеєм, синьогнійною паличкою, паличкою Фрідлендера, кишковою та дизентерійною паличками, сальмонелами, стафілококами, стрептококами, патогенними анаеробами, включаючи збудників газової гангрени.

Активний відносно штамів бактерій, резистентних до антибіотиків, сульфаніламідів, нітрофуранів та інших препаратів.

Показання: гнійно-запальні процеси різної локалізації: гнійні плеврити, емпієма плеври, абсцес легенів, перитоніт, цистит, рани з глибокими порожнинами, абсцеси м'яких тканин, флегмони, післяопераційні рани сечо- та жовчовивідних шляхів.

Також застосовується для профілактики інфекційних ускладнень після катетеризації сечового міхура.



ДІОКСИДИН

Застосовують в умовах стаціонару.

Експериментально виявлено тератогенну та ембріотоксичну дії препарату (тому він протипоказаний під час вагітності); препарат чинить також мутагенну дію.

У зв'язку з цим його призначають тільки при тяжких формах інфекційних захворювань або при неефективності інших антибактеріальних препаратів, у тому числі цефалоспоринів II–IV поколінь, фторхінолонів, карбапенемів.

Не допускається безконтрольне застосування діоксидину та ЛФ, які його містять.

Застосовують також місцево, накладаючи на ранову поверхню пов'язки, змочені 1 % розчином.

Діоксизоль володіє сильним місцевоанестезуючим та помірним гіперосмолярним ефектом, купірує ранове та перифокальне запалення, стимулює процеси репарації та активність фагоцитів у рані.

Стерильний перев'язувальний матеріал рясно насичати розчином і наносити на поверхневі опіки, після чого накласти стерильні серветки, які фіксують бинтом або лейкопластиром. Пов'язки змінювати при лікуванні опіків 1 раз на 7–14 днів, при лікуванні ран – 1 раз на добу.



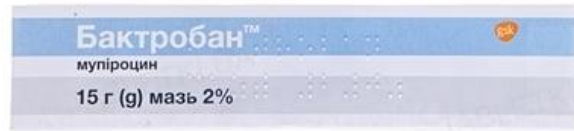
МУПІРОЦИН

антибактеріальний засіб для місцевого застосування, активний щодо м/о, які викликають більшість інфекційних захворювань шкіри, серед яких *Staphylococcus aureus*, включаючи метицилін-резистентні штами, інші стафілококи та стрептококи. Також активний щодо до Г- м/о, таких як *Escherichia coli* та *Haemophilus influenzae*.

Механізм дії: пригнічення бактеріальної ізолейцил-трансфер-РНК-синтетази, завдяки чому перехресна резистентність з іншими антибіотиками не очікується.

При застосуванні у мінімально інгібуючих концентраціях має бактеріостатичні властивості, а при застосуванні у більш високих концентраціях, які досягаються при місцевому застосуванні, – бактерицидні властивості.

Показання: місцеве лікування бактеріальних інфекцій шкіри, наприклад імпетиго, фолікуліту, фурункульозу.



МУПІРОЦИН

Місцеве лікування інфекцій носової порожнини, спричинених *Staphylococcus aureus*, включаючи метицилінрезистентні штами.

Невелику кількість мазі (розміром приблизно з голівку сірника) поміщати у кожную ніздрю 2–3 рази на добу протягом 5 днів.

Після застосування мазі закрити ніздрі носа пальцями, натискуючи кілька разів на крильця носа з обох боків, та м'яко потерти крильця носа для кращого розподілення мазі всередині носа.

Звільнення носової порожнини від збудників зазвичай відбувається через 3–5 днів лікування.

Лікування не повинно тривати більше 10 діб.



БАКТЕРІОФАГИ

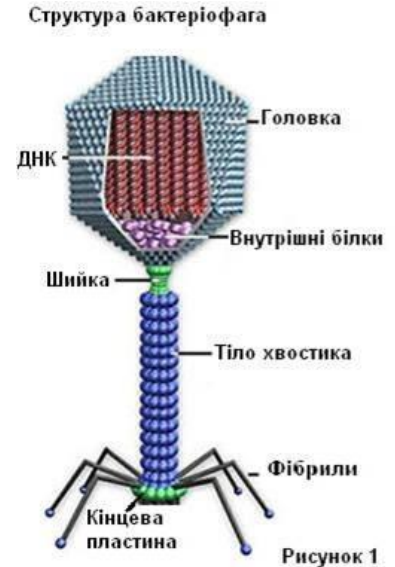
Бактеріофаги (віруси бактерій) специфічно вражають бактеріальні клітини, розмножуються всередині бактеріальної клітини та руйнують її шляхом лізису.

Антибактеріальний ефект зумовлений специфічним лізисом патогенних бактерій, при цьому препарат не порушує стан нормальної мікрофлори.

Під дією бактеріофага відбувається активація фагоцитозу, підвищується активність нейтрофілів та їхня метаболічна активність, що перешкоджає появі рецидиву інфекційного захворювання та хронізації запального процесу.

Знижується кількість лейкоцитів і нейтрофілів, а рівень лімфоцитів підвищується переважно за рахунок Т-лімфоцитів.

Бактеріофаги протягом короткого часу проникають в кров та лімфу і виводяться нирками з сечею.



БАКТЕРІОФАГИ

Показання

Лікування та профілактика гнійно-запальних і кишкових захворювань, викликаних стафілококами, стрептококами, синьогнійною паличкою, патогенною кишковою паличкою різних серогруп, протеем.

Препарат застосовують як монотерапію або у складі комбінованого лікування.

Важливою умовою ефективної фаготерапії є попереднє визначення фагочутливості збудника захворювання.

Застосування препарату починають якомога раніше. Препарат не застосовують у разі помутніння розчину.



БАКТЕРІОФАГИ

Показання: лікування та профілактика таких захворювань, як: шигельоз, сальмонельоз, дисбактеріоз, ентероколіт, коліт інфекційної природи, змішаної етіології.

Препарат призначений для застосування всередину (перорально).

З лікувальною метою бактеріофаг приймають перорально 4 рази на добу за 1 годину до прийому їжі. Тривалість лікування 7–10 діб.

