

Макролиды

Выполнил: студент 3 курса 3 группы ЛФ
Ковалевич Александр Владимирович

Определение

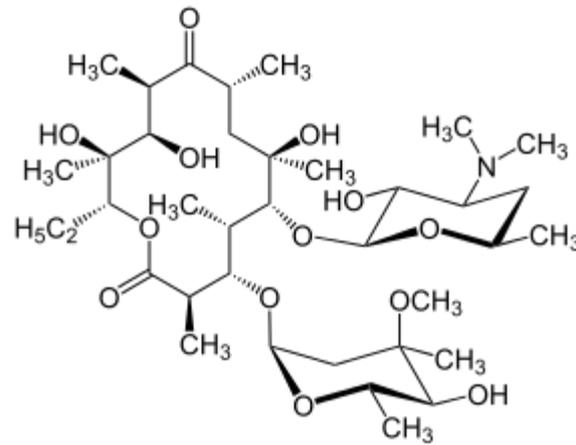
Макролиды – это группа малотоксичных антибиотиков, основой химической структуры которых является **макроциклическое лактонное кольцо**, к которому присоединены один или несколько **углеводных остатков**. Макролиды – соединениям естественного происхождения, относятся к классу *поликетидов*.



I. История

Пионером класса макролидов является **эритромицин**, который впервые был получен в **1952 году** из *почвенного актиномицета* *Streptomyces erythreus*, учёными из американской фармацевтической компании “Эли Лилли”.

Он использовался для лечения инфекций, вызванных грамположительными бактериями как альтернативный препарат у пациентов с аллергией на пенициллины. Используется и по сей день.



Химическая формула
Эритромицина



The Lilly logo, featuring the word "Lilly" in a red, cursive script font.



Стрептомицеты

Спирамицин выделен в 1951 и формально описан в 1954 году как активное в отношении грамположительных микроорганизмов вещество. В США не прошёл регистрацию FDA (Food and Drug Administration). Может применяться для лечения токсоплазмоза у беременных.

В 70—80-х годах увеличилась сфера применения макролидов, что послужило стимулом для разработки и внедрения в клинику новых макролидных препаратов, обладающих улучшенными фармакокинетическими и микробиологическими параметрами (**джосамицин** – 1967 г, **кларитромицин** – 1980 г., **рокситромицин** – 1987 г., **азитромицин** – 1988г., **мидекамицин** – 1988г., **диритромицин** – 1993г.

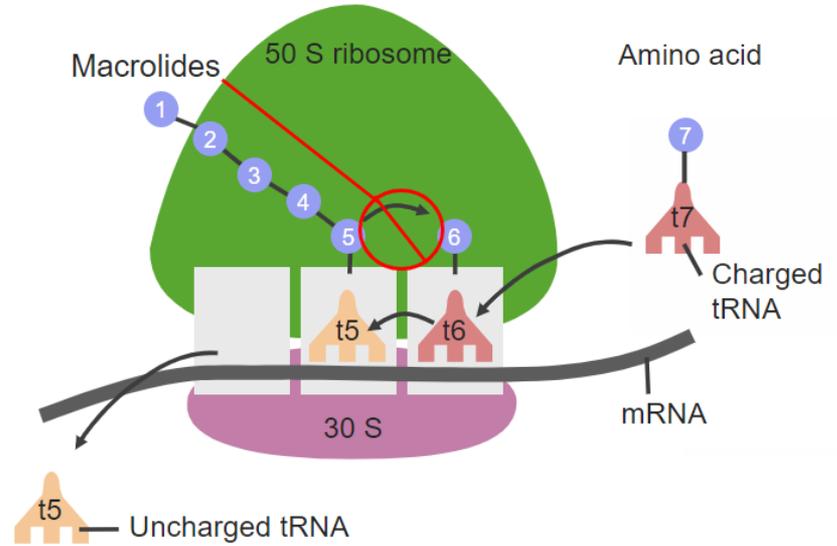


II. Классификация

Группы макролидов	Природные	Полусинтетические
14-членные	Эритромицин Олеандомицин	Кларитромицин Рокситромицин Телитромицин Диритромицин Флуритромицин
15-членные (азалиды)		Азитромицин
16-членные	Мидекамицин Спирамицин Джосамицин	Мидекамицин ацетат

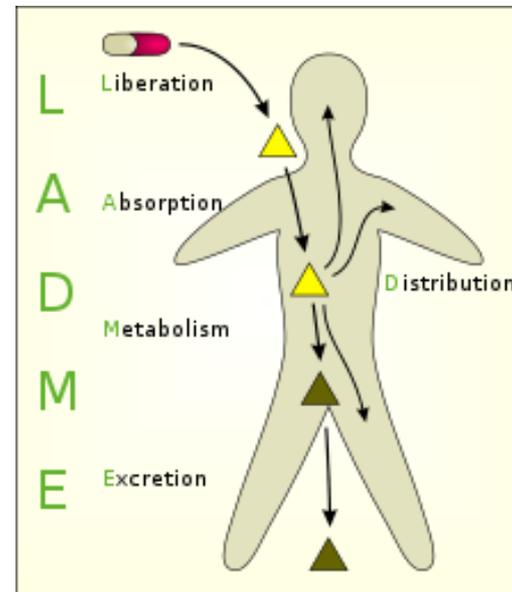
III. Механизм действия

Макролиды присоединяются к рибосомальной субъединице 50s - это приводит к нарушению процесса транслокации вновь синтезированной тРНК с акцепторного участка на донорский участок рибосомы, что, в конечном итоге, тормозит синтез белка микробной клетки.



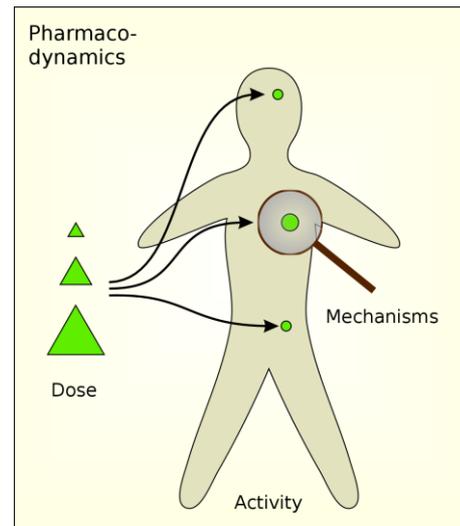
IV. Фармакокинетика

1. При приёме внутрь всасываются в ЖКТ неполностью, но в достаточной степени для того, чтобы в крови и тканях создались бактериостатические концентрации.
2. Легко проникают в различные клетки (в том числе фагоциты) и ткани (в том числе через плаценту).
3. Практически не проходят через ГЭБ и не попадают в ткани глаза.
4. Метаболизируются в печени, в основном выводятся с желчью, в меньшей степени - с мочой.



V. Фармакодинамика

1. **14-членные** макролиды значительно ингибируют цитохром P450 (*кларитромицин, эритромицин, рокситромицин*) - это приводит к повышению токсичности других лекарств, метаболизирующихся в печени.
2. **Мидекамицин, телитромицин, джосамицин** - в меньшей степени ингибируют цитохром P450.
3. **Азалиды (азитромицин)** почти не метаболизируются в печени - лекарственных взаимодействий нет.



VI. Применение

1. При аллергии на пенициллины, препараты выбора для лечения инфекций органов дыхания (тонзиллофарингит, внебольничная пневмония, синуситы, отиты) - действуют на всех основных возбудителей данных инфекций.
2. При коклюше, дифтерии, инфекциях мочеполового тракта (хламидиозы, уреаплазмозы, мягкий шанкр), эритразме и ородентальной инфекции.
3. При токсоплазмозе - **спирамицин**.
4. Хеликобактерная инфекция (гастриры, язвенная болезнь) - **кларитромицин**.
5. Препараты **второго ряда** (исп-ся при аллергии на пенициллин) для лечения сифилиса, инфекциях кожи и мягких тканей.

6. При болезни Лайма - **Азитромицин** (пр. второго ряда - при аллергии на амоксицилин и доксицилин)

7. При аллергии на тетрациклины, для лечения угревой сыпи.



Симптомы БОЛЕЗНИ ЛАЙМА

Ранние симптомы
(3-30 дней
после укуса клеща)



Головная боль



Лихорадка



Усталость



Поздние симптомы



Учащенное сердцебиение



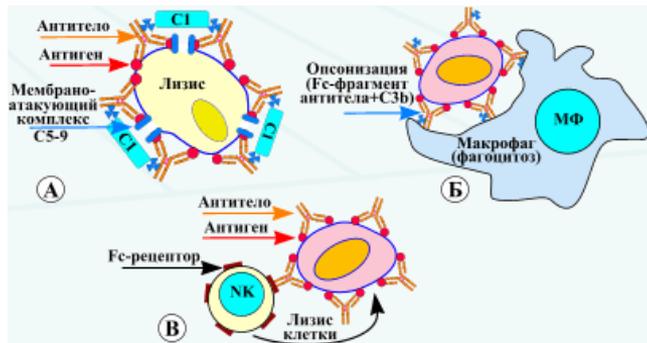
Очаг воспаления на коже



Головокружение

VII. Побочные реакции:

1. Нарушение ЖКТ (тошнота, рвота, боли в животе)
2. Обратимое ухудшение слуха (в/в введение больших доз эритромицина, кларитромицина) - **очень редко.**
3. Постинъекционные тромбофлебиты - **очень редко.**
4. Аллергические реакции - **очень редко.**
5. Суперинфекции (кандидомикоз и др.) - **очень редко.**



Эритромицин

1. Форма выпуска и дозы:

- а) Таблетки/Капсулы (100,250,500 мг), б) Суспензия для приёма внутрь (200мг, 400мг/5мл),
в) Мазь (10000 ЕД/1г) 15г, глазная мазь 10г. г) Гель (25 мг/1г) 30г.



Эритромицин

2. Побочные эффекты:

- а) Сильное прокинетическое действие (агонист рецепторов мотилина) - рвота и диарея.
- б) Мощный блокатор цитохрома P450 - повышает токсичность других лекарств, замедляя их метаболизм.
- в) Может вызывать **холестатический гепатит**.



Кларитромицин

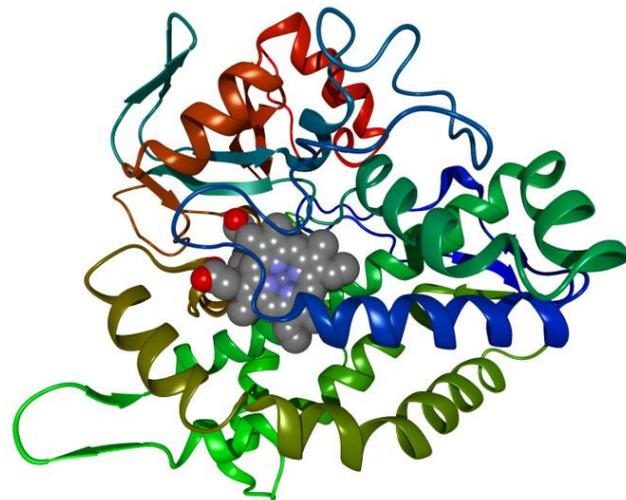
1. Форма выпуска и дозы:

а) Табл. (250, 500 мг). б) Таблетки пролонгированного действия (ER) 500 мг.

в) Суспензия для приёма внутрь (125, 250/5мл), г) Флакон 500мг

2. Побочные эффекты:

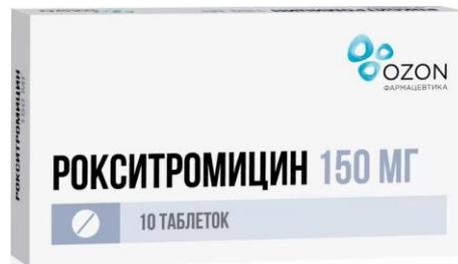
а) Ингибирование цитохрома P450 (т.е. вызывает лекарственные взаимодействия)



цитохром P450

Рокситромицин

1. Форма выпуска и дозы: а) Капс. (150мг)



Диритромицин

1. Форма выпуска и дозы: а) Табл. (250 и 500 мг.)

Азитромицин

1. Форма выпуска и дозы:

а) Капс. (250мг); б) Табл. (125,500мг); в) Сироп (100,200мг/5мл); г) Флак. (500мг).

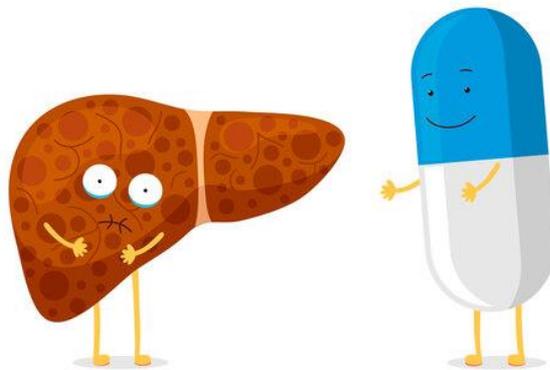


Спирамицин

1. Форма выпуска и дозы:

а) Капс. (500мг (1.5млн. МЕ)).

б) Флак. 1.5 млн. МЕ.



Телитромицин

1. Форма выпуска и дозы: а) Табл. (400мг).

2. Побочные эффекты:

а) Гепатотоксичность (может вызвать тяжёлый гепатит, гепатонекроз);

б) Проаритмогенное действие;

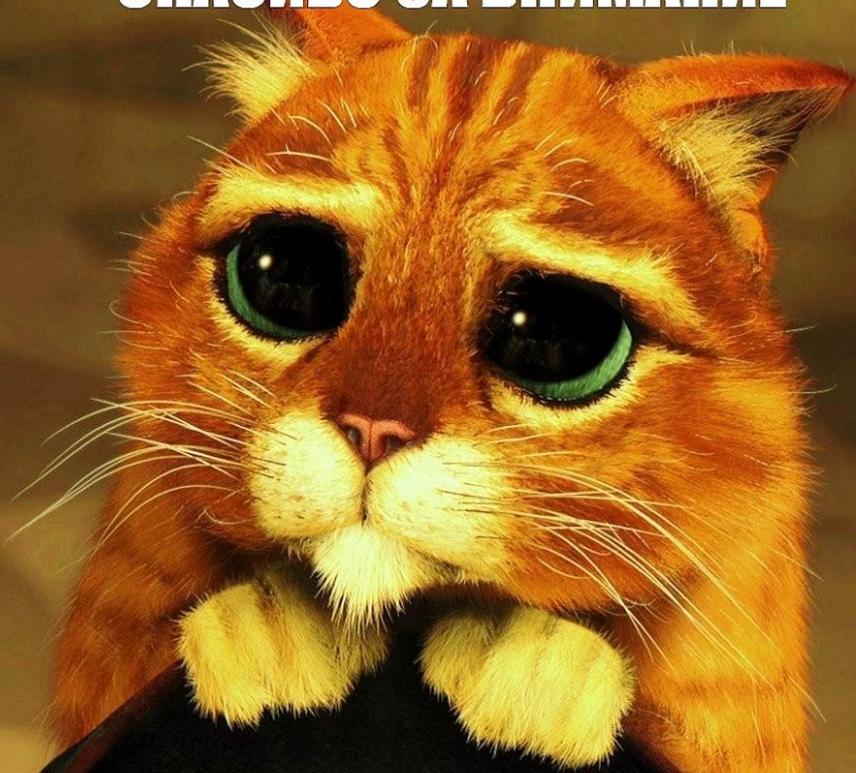
в) Утяжеление миастении гравис;

г) Нарушения зрения;

д) Кратковременная потеря сознания;



СПАСИБО ЗА ВНИМАНИЕ



ПОСТАВЬТЕ 10 ПОЖАЛУЙСТА

Shrek, Shrek 2 © Shrek the Third™ and © 2007 DreamWorks Animation LLC.

СТАТУС ОДНОКЛАССНИК
DREAMWORKS
ANIMATION LLC
meme-arsenal.ru