ПРОТИВОГРИБКОВЫЕ СРЕДСТВА

Студент: Койшибаев Р
Факультет: Стоматология
Курс: 3
Группа: 309А

КАЗАХСТАНСКО-РОССИЙСКИЙ
МЕДИЦИНСКИЙ УНИВЕРСИТЕТ

План

1. Описание
2. Бифоназол
3. Вориконазол
4. Дисульфид селена
5. Кетоконазол
6. Нистатин

Описание

В последние десятилетия отмечается значительный рост грибковых заболеваний. Это связано со многими факторами и, в частности, с широким применением в медицинской практике антибиотиков широкого спектра действия, иммунодепрессантов и других групп ЛС.

В связи с тенденцией к росту грибковых заболеваний (как поверхностных, так и тяжелых висцеральных микозов, ассоциированных с ВИЧ-инфекцией, онкогематологическими заболеваниями), развитием устойчивости возбудителей к имеющимся ЛС, выявлением видов грибов, ранее считавшихся непатогенными (в настоящее время потенциальными возбудителями микозов считаются около 400 видов грибов), возросла потребность в эффективных противогрибковых средствах.

Противогрибковые средства (антимикотики) — лекарственные средства, обладающие фунгицидным или фунгистатическим действием и применяемые для профилактики и лечения микозов.

Для лечения грибковых заболеваний используют ряд лекарственных средств, различных по происхождению (природные или синтетические), спектру и механизму действия, противогрибковому эффекту (фунгицидный или фунгистатический), показаниям к применению (местные или системные инфекции), способам назначения (внутрь, парентерально, наружно).

Существует несколько классификаций лекарственных средств, относящихся к группе антимикотиков: по химической структуре, механизму действия, спектру активности, фармакокинетике, переносимости, особенностям клинического применения и др.

Бифоназол

Фармакологическое действие

Противогрибковое средство. Обладает фунгистатическим и фунгицидным действием. Нарушает синтез эргостерина, входящего в состав клеточной мембраны гриба, что в результате приводит к изменению её структуры и свойств. Применяется для местной терапии поверхностных микозов.

Бифоназол эффективен в отношении:

дерматофитов, дрожжеподобных грибов, грибов рода Candida,

плесневых грибов и грибов, вызывающих перхоть (Malassezia),

Corynebacterium minutissimum (англ.)русск..

Фармакокинетика

Бифоназол хорошо проникает в пораженные слои кожи. Абсорбция - 0.6-0.8%, концентрация в плазме крови не определяется. Через 6 ч после применения концентрация в коже достигает или во много раз превосходит минимальную эффективную концентрацию для основных грибов, вызывающих дерматомикозы. Проникает в кожу глубже других производных имидазола (кетоконазол, клотримазол), сохраняя высокую концентрацию в течение 48-72 часов. Бифоназол не вызывает развития устойчивости и даже снижения чувствительности дерматофитов к нему.[1]

Вориконазол

Показания

Для пациентов с 12 лет[3]:

инвазивный аспергиллёз

кандидемия и диссеминированный кандидоз

кандидоз пищевода

инфекции вызванные Scedosporium apiospermum, Fusarium (включая Fusarium solani) при непереносимости или рефрактерности к другим препаратам.

Дисульфид Селена

Дисульфид селена — бинарное неорганическое соединение селена и серы с формулой SeS_2. Имеет желтовато-красный цвет. Не растворяется в воде. Получается действием сероводорода на раствор селенистой кислоты[1].

Применяется в качестве противогрибкового компонента [en] шампуней против перхоти, себорейного дерматита[2], вызванного дрожжеподобными грибками рода *Malassezia*[3].

Кетоконазол

Фармакологическое действие

Противогрибковое средство, обладает активностью в отношении дерматофитов, дрожжевых грибов, диморфных грибовии эумицетов. Активен также в отношении стафилококков и стрептококков.

Механизм действия заключается в ингибировании синтеза эргостерола мембраны грибов и нарушении проницаемости клеточной стенки.

Неэффективен в отношении *Aspergillus* и *Zygomycetes*[2]. Уменьшает образование андрогенов.

Фармакокинетика

Абсорбция — высокая (особенно в кислой среде желудка). Биодоступность находится в прямой зависимости от величины принятой дозы. Связывается с белками плазмы и эритроцитами. TCmax — 2 ч. Динамика концентрации в крови описывается биэкспоненциальной кривой. Хорошо распределяется в тканях и жидкостях организма: проникает в воспалительный экссудат, слюну, желчь, мочу, ушную серу, секрет сальных желез, фекалии, сухожилия, кожу и мягкие ткани. В незначительных количествах попадает в СМЖ и тестикулы (не создает терапевтических концентраций), проникает через плаценту и в грудное молоко.

Метаболизируется в печени (окислительное о-дезоксилирование, окислительная деградация, ароматическое гидроксилирование). Является ингибитором изоферментов CYP2C19 и CYP3A4, CYP3A5, CYP3A7.

Выводится в неизмененном виде и в виде неактивных метаболитов: за 4 сут выводится 70 % от принятой дозы (57 % — с желчью и 13 % — почками). T1/2 — 2-4 ч.

Нистатин

Фармакологическое действие

Полиеновый противогрибковый антибиотик, высокоактивный в отношении дрожжеподобных грибов рода Candida. В структуре антибиотика имеются двойные связи, обладающие высокой тропностью к стероловым структурам клеточной мембраны грибов, что способствует встраиванию молекулы препарата в мембрану клетки и образованию большого количества каналов, через которые осуществляется бесконтрольный транспорт электролитов;
повышение осмолярности внутри клетки приводит к её гибели. Резистентность развивается очень медленно.

Фармакокинетика

Обладает слабым резорбтивным действием (практически не всасывается в желудочно-кишечном тракте). Выводится через кишечник. Не кумулируется. При местном применении практически не всасывается через слизистые оболочки.