

# 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.<sup>[1]</sup>



# Вориконозол

## Показания

Для пациентов с 12 лет<sup>[3]</sup>:

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  $\text{SeS}_2$ . Имеет желтовато-красный цвет. Не растворяется в воде. Получается действием сероводорода на раствор селенистой кислоты<sup>[1]</sup>.

Применяется в качестве противогрибкового компонента<sup>[en]</sup> шампуней против перхоти, себорейного дерматита<sup>[2]</sup>, вызванного дрожжеподобными грибами рода Malassezia<sup>[3]</sup>.



# Кетоконазол

## Фармакологическое действие

Противогрибковое средство, обладает активностью в отношении дерматофитов, дрожжевых грибов, диморфных грибов и 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<sup>[2]</sup>.  
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.  $T_{Cmax}$  — 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-дезоксигирование, окислительная деградация, ароматическое гидроксигирование). Является ингибитором изоферментов CYP2C19 и CYP3A4, CYP3A5, CYP3A7.

Выводится в неизменном виде и в виде неактивных метаболитов: за 4 сут выводится 70 % от принятой дозы (57 % — с желчью и 13 % — почками).  $T_{1/2}$  — 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.