

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ФОРМЫ, ИЗГОТОВЛЕННЫЕ ИЗ АНТИБИОТИКОВ

Сатимбоева Халимахан Каримовна

*Андижанский техникум общественного
здравоохранения имени Абу Али Ибн Сины*

заведующая кафедрой фармации,

khalimasatimboyeva@gmail.ru

Аннотация: В статье рассматриваются вопросы рациональной антибиотикотерапии с учетом фармакодинамических свойств антибиотиков. Особое внимание уделено лекарственным средствам с замедленным высвобождением и избирательным распределением активной субстанции с использованием технологии “солютаб”. Данная технология обеспечивает контролируемое высвобождение препарата за счет микрочастиц, которые состоят из активного вещества, связанного с неактивным наполнителем. Обсуждаются особенности и фармакокинетические характеристики ряда новых пероральных форм антибиотиков.

Ключевые слова: пероральные лекарственные формы, антибиотики, фармакокинетика, замедленное высвобождение.

На сегодняшний день проблема рациональной антибиотикотерапии актуальна как никогда. Современная медицина находится в условиях глобального распространения резистентных и полирезистентных штаммов возбудителей, что в значительной степени связано с неправильным использованием антибактериальных препаратов как со стороны врача, назначающего препарат, так и со стороны пациента, не соблюдающего врачебные предписания. Ситуацию усугубляет сокращение производства новых антибиотиков, связанное с экономическими и организационными причинами. Не секрет, что процесс внедрения новой лекарственной субстанции требует колоссального количества сил и материальных затрат и может затянуться на несколько десятков лет. Поэтому эффективность лечения инфекций в настоящем и будущем зависит от целесообразности использования существующих антибактериальных препаратов.

Существуют различные **лекарственные формы** (ЛФ) антибиотиков: для перорального, парентерального и местного использования. Каждая из этих форм имеет свои преимущества и недостатки, которые касаются в основном фармакокинетических характеристик и профиля переносимости. Поэтому современные разработки направлены не только на создание совершенно новых субстанций, но и на улучшение фармакокинетических

свойств существующих антибиотиков, что позволяет повысить приверженность пациентов к лечению, уменьшить число нежелательных эффектов и добиться лучших терапевтических результатов.

С этой целью созданы лекарственные средства с модифицированным, замедленным высвобождением и избирательным распределением активной субстанции. Среди инновационных разработок достойное место занимают ЛФ, обеспечивающие равномерную дисперсию частиц, так называемые растворимые формы, а также липосомальные формы антибиотиков; в практику внедрены ингаляционные формы для лечения некоторых хронических инфекций дыхательных путей.

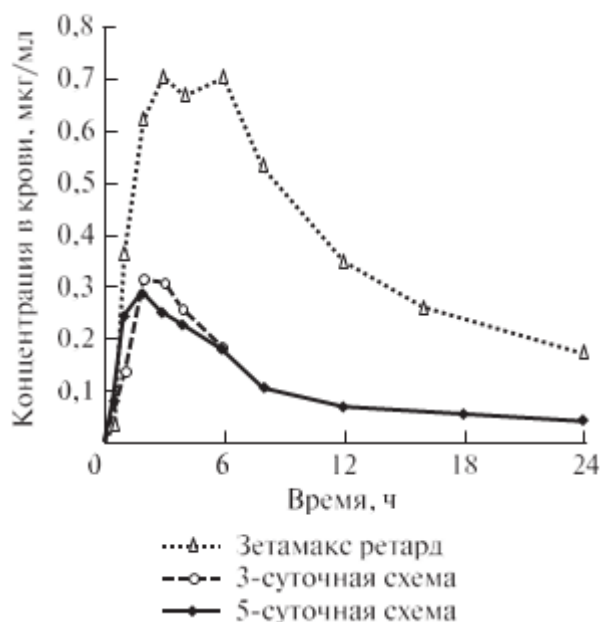
Азитромицин – азалидный антибиотик, который успешно используется для лечения инфекций различной локализации; его эффективность сопоставима с эффективностью других антимикробных препаратов (β -лактамов). Благодаря сходству антибактериального спектра и механизмов развития бактериальной резистентности препарат относится к группе макролидов. Однако он имеет целый ряд фармакокинетических особенностей, что послужило основанием для разработки новых ЛФ с более эффективными режимами приема. Высокая клиническая эффективность азитромицина в совокупности с длительным периодом полувыведения и уникальными внутрилегочными фармакокинетическими особенностями послужили основой для использования в однократной нагрузочной дозе.

Препарат имеет длительный период полувыведения (>50 ч), который обеспечивает эффективность короткого курса лечения (1–3 дня). При первых попытках использования препарата у детей специалисты практически не учитывали его фармакокинетические свойства. Для лечения стрептококковых фарингитов и **острых средних отитов (ОСО)** производитель рекомендовал использовать препарат в дозе 12,5 мг/кг ежедневно в течение 10 дней, что было основано на режимах перорального применения пенициллина и цефалоспоринов. В США для лечения ОСО рекомендовалась доза 10 мг/кг в первый день и по 5 мг/кг в последующие дни в течение 4 дней, что было вполне оправданно, поскольку 5-дневный курс лечения обеспечивал терапевтическую концентрацию препарата на 10 дней. Последние изменения рекомендуемой дозы азитромицина для лечения ОСО у детей (10 мг/кг за 3 дня или 30 мг/кг однократно) способствовали оптимизации эффективности препарата и базировались на раннем переносе основного количества препарата в очаг инфекции, что было доказано в ряде клинических исследований. Высокий клинический успех данного способа введения позволил более глубоко изучить возможность дозирования азитромицина.



Новая ЛФ азитромицина в микросферах (зетамакс ретард) позволяет назначить однократно курсовую пероральную дозу препарата, которая безопасна в использовании и хорошо переносится пациентами. Азитромицин встраивают в матрикс микросфер, а затем препарат медленно высвобождается путем диффузии через поры микросферы (рис. 4). Зетамакс ретард обеспечивает раннюю доставку большего количества препарата в очаг инфекции. После однократного применения максимальная концентрация препарата в лейкоцитах в период вероятного максимального содержания бактерий значительно выше.

С целью сравнения эффектов однократного приема зетамакса ретард в дозе 2 г и обычной ЛФ азитромицина при 3- и 5-дневных схемах проводилось определение основных фармакокинетических параметров перечисленных схем терапии (табл. 4, рис. 5). Оказалось, что в первый день зетамакс ретард обеспечивает в 3 раза более высокий уровень системного воздействия: C_{max} и AUC_{24} были в 2 и 3 раза выше, чем после приема в течение 3 или 5 дней соответственно. Нагрузочная доза усиливает антимикробное действие азитромицина благодаря увеличению отношения $AUC_{24}/МИК$, что способствует более быстрому уничтожению бактерий и благоприятно сказывается на течении заболевания. Таким образом, фармакокинетические/фармакодинамические параметры являются предикторами высокой эффективности зетамакса ретард.



К настоящему времени в ряде клинических исследований доказана высокая клинико-бактериологическая эффективность однократной курсовой дозы азитромицина в микросферах (зетамакс ретард) для лечения инфекций верхних и нижних дыхательных путей у взрослых, которая сопоставима с применением стандартных курсов других препаратов (левофлоксацин и кларитромицин). Кроме того, результаты клинических исследований свидетельствуют о благоприятном профиле переносимости зетамакса ретард.

Список литературы:

1. М.А. Мухина, М.В. Леонова Новые пероральные лекарственные формы антибиотиков, Клиническая фармакология журнал 1.2012 год.
2. Веб сайт <https://studfile.net/preview/1902750/page:110/>
3. Веб сайт https://studopedia.ru/20_99512_lekarstvennie-formi-antibiotikov.html