

Nitroimidazolová antibiotika

Nitroimidazolová antibiotika tvoří skupinu antibiotik chemicky odvozených od imidazolu. Řadíme mezi ně **metronidazol**, **nimorazol** a **tinidazol**.

Struktura

Jedná se o izomery imidazolu obsahující jednu nitroskupinu. ^[1]

Mechanismus účinku

Mechanismus účinku spočívá ve vytvoření reaktivních meziproduktů při redukci nitroskupiny. Tyto meziprodukty způsobují přerušení řetězce DNA. To vysvětluje jejich antimikrobiální, ale i mutagenní efekt (kancerogenní při pokusu na zvířatech). Díky dobrému zásobení lidské buňky kyslíkem a penetrační bariéře jaderné membrány jsou lidské buňky vůči tomuto účinku více odolné. ^[2]

Antimikrobiální spektrum

- obligátně anaerobní bakterie (s výjimkou aktinomycet).
- na protozoa (*Entamoeba histolytica*, *Trichomonas vaginalis*, *Giardia lamblia*)

Typ účinku je baktericidní. ^[2]

Farmakokinetika

Metronidazol se při perorálním podání rychle a kompletně resorbuje, při vaginální aplikaci je resorpce pomalejší a čítá 20–50 %. Vazba na plazmatické bílkoviny je velice nízká. V játrech se oxiduje a glukuroniduje. Malé množství se redukuje bakteriemi střevní flóry. Metabolity jsou vylučovány močí a biologický poločas je 6–10 hodin. Při onemocnění jater může dojít ke zpožděné eliminaci. ^[2]

Indikace

- anaerobní infekce (také při eradikaci *Helicobacter pylori*), při pseudomembranózní kolitidě pouze tehdy, pokud není možnost léčby
- trichomoniáza a bakteriální vaginózy
- všechny formy amebiázy
- střevní infekce způsobené lamblíemi
- perioperační profylaxe při velkých gynekologických operacích a při operacích tlustého střeva
- na základě imunosupresivního účinku možné použití při terapii Crohnovy choroby

Metronidazol a eradikace *Helicobacter pylori*

Ačkoliv *Helicobacter pylori* je in vitro citlivý vůči řadě antibakteriálních látek, je jeho eradikace v žaludeční sliznici obtížná. Sedmidenní trojkombinace léků k eradikaci *H. pylori* zahrnuje inhibitor protonové pumpy + 2 antibiotika.

Možné kombinace léčiv

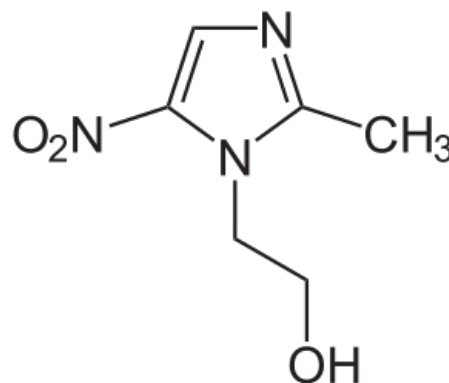
- inhibitory protonové pumpy + klarithromycin + amoxicilin (tzv. francouzská trojkombinace)
- inhibitory protonové pumpy + klarithromycin + metronidazol

Ukázalo se, že francouzská kombinace vykazuje lepší výsledky. Při kombinaci s metronidazolem je vyšší riziko rezistence (30–50 %).

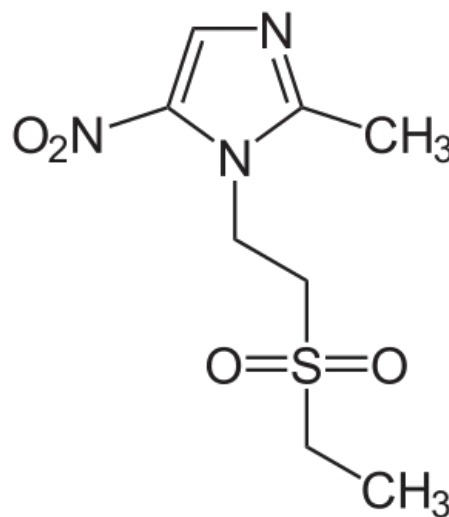
Metronidazol při léčbě Crohnovy choroby

Při terapii Crohnovy nemoci je lékem první volby mesalazin, ale ve druhé volbě je lékem volby metronidazol, především při perianálních píštělích.

Metronidazol při léčbě amebiázy



Metronidazol




Tinidazol

Při amebiáze je metronidazol lékem první volby, v dávce třikrát denně 750 mg 3–5 dnů, v těžších případech 10 dnů.^[2]

Kontraindikace

Nitroimidazolová antibiotika jsou kontraindikována v těhotenství. Při kojení nejsou též vhodná, protože přecházejí do mateřského mléka.^[2]

Dávkování

Účinná látka	Denní dávka
Metronidazol 	1200 mg
Tinidazol 	1000 mg
Nimorazol 	1000 mg

Léčba by neměla trvat déle než 10 dnů. V případě porušené funkce jater je třeba dávku redukovat.^[2]

Nežádoucí účinky

Nežádoucí účinky jsou závislé na výši podané dávky. Mezi časté patří gastrointestinální poruchy nebo kovová pachuť v ústech. Při vyšších dávkách se mohou vyskytnout bolesti hlavy, vertigo, parestézie, exantém a vzácně reverzibilní leukopenie.^[2]

Interakce

Metronidazol zesiluje účinek a snižuje eliminaci:

- orálních antikoagulancií
- fenytoinu
- fluorouracilu
- lithiových iontů

Cimetidin zpomaluje eliminaci metronidazolu. Fenytoin a fenobarbital urychlují eliminaci metronidazolu.^[2]

Odkazy

Externí odkazy

- Metronidazole (článek na anglické Wikipedii)

Související články

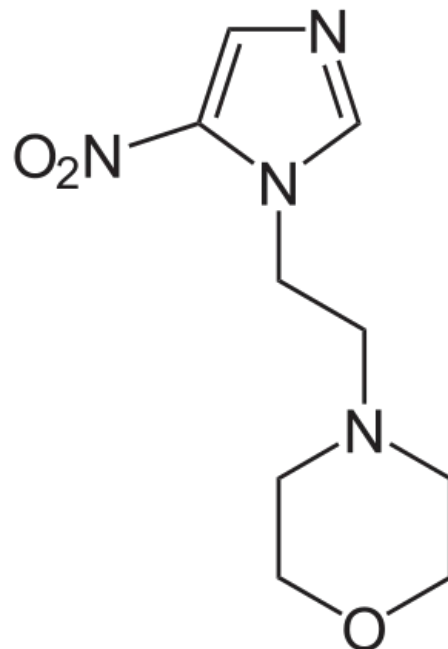
- Antibiotika

Reference

- EVERYKING,. *Nitroimidazole* [online]. [cit. 2015-06-17]. <<https://en.wikipedia.org/wiki/Nitroimidazole>>.
- MUTSCHLER, Ernst, Gerd GEISSLINGER a Heyo K KROEMER, et al. *Arzneimittelwirkungen : Lehrbuch der Pharmakologie und Toxikologie*. 8. přepracované vydání. Wissenschaftliche Verlagsges. 2001. s. 644-647; 820-822; 866-867. ISBN 3804717632.

Použitá literatura

- LÜLLMANN, Heinz a Klaus MOHR. *Barevný atlas farmakologie*. 4. vydání. Praha : Grada, 2012. ISBN 9788024739083.



Nimorazol