

## Глава 11. Оксазолидиноны

Оксазолидиноны — один из новых классов синтетических антибактериальных препаратов. В настоящее время в клинической практике применяют два препарата группы оксазолидинонов — **линезолид** и **тедизолид** (табл. 40). Механизм их антибактериального действия обусловлен ингибированием синтеза белка в микробной клетке за счет связывания с 50S-субъединицей бактериальной рибосомы. Основное клиническое значение оксазолидиноны имеют как препараты для терапии инфекций, вызванных грамположительными кокками, которые устойчивы ко многим другим антибиотикам, в том числе MRSA, пенициллино-резистентными пневмококками и ванкомицинорезистентными энтерококками. Тедизолид, с учетом результатов законченных клинических исследований применяется только при осложненных инфекциях кожи и мягких тканей.

### ЛИНЕЗОЛИД

Обладает узким спектром активности и преимущественно бактериостатическим эффектом. На пневмококк, *B. fragilis* и *C. perfringens* может действовать бактерицидно. Наличие в/в и пероральной лекарственных форм позволяет использовать препарат методом ступенчатой терапии.

#### Спектр активности

Грам(+) кокки: стафилококки — *S. aureus* (включая MRSA), коагулазонегативные стафилококки (включая MRSE); стрептококки, в том числе БГСА и *S. pneumoniae* (включая пенициллинорезистентные штаммы); энтерококки — *E. faecalis*, *E. faecium* (включая ванкомицинорезистентные штаммы).

Грам(+) палочки: коринебактерии, листерии и др.

Грам(-) кокки: *M. catarrhalis*, *N. gonorrhoeae* (умеренная активность).

Грам(-) палочки: *H. influenzae*, *Legionella* spp., *B. pertussis*, *F. meningosepticum*, *P. multocida* (умеренная активность).

*M. tuberculosis* включая штаммы, устойчивые ко многим противотуберкулезным ЛС.

Анаэробы: спорообразующие — клостридии (кроме *C. difficile*); неспорообразующие — пептострептококки, превотеллы, фузобактерии, некоторые штаммы *B. fragilis*.

#### Фармакокинетика

Хорошо всасывается в ЖКТ, биодоступность (около 100%) не зависит от пищи. Создает высокие концентрации во многих органах, тканях и средах. Метаболизируется в печени (без участия цитохрома P450). Выводится с мочой, преимущественно в форме неактивных метаболитов (в неизмененном виде 30–35%).  $T_{1/2}$  — 4,5–5,5 ч, существенно не изменяется при нарушении функции печени или почек.

