

který je jejich koncentrace nad MIC, ale vyšší sérové hladiny (tedy vyšší dávky) již nejsou účinnější (7).

Flukloxacilin dosahuje hodinu po podání 500 mg p. o. vrcholové hladiny 14,5 mg/l, ještě po 4 hodinách je plasmatická hladina 2,2 mg/l, po 6 hodinách klesá pod 1,0 mg/l. Kmeny *S. aureus* citlivé k meticilinu (MSSA) mají obvyklé hodnoty MIC 0,1–0,5 mg/l, beta-hemolytické streptokoky mívají MIC 0,05–0,1 mg/l. Biologická dostupnost se udává 55–80 %, až 95 % je vázáno na plasmatické bílkoviny.

Amoxicilin dosahuje 2 hodiny po užití 500 mg vrcholové hladiny 8–10 mg/l, obvyklá MIC beta-hemolytických streptokoků je 0,01 mg/l, u *Enterococcus faecalis* 0,5 mg/l. Biologická dostupnost amoxicilinu je 75–90 %, vazba na plasmatické bílkoviny nízká (17–20 %). Je zřejmé, že po velkou část dávkovacího intervalu přesahuje hladina flukloxacilinu resp. amoxicilinu MIC, ještě přesvědčivější je tato skutečnost při dávkách 1 g.

Amoxicilin-klavulanát má biologickou dostupnost 80 %, hodinu po dávce 625 mg p. o. dosáhne v séru hladiny 7,2 mg/l (amoxicilin) resp. 2,4 mg/l (klavulanát). Poločas je 1,3 (resp. 1,0) hodiny, vazba na plasmatické proteiny 18 (resp. 25) %.

Cefuroxim-axetil je prodrug s dobrou biologickou dostupností (cca 50 %), pokud je podáván s jídlem. Ve střední sliznici dochází k deesterifikaci na cefuroxim, po dávce 500 mg p. o. dosahuje vrcholové hladiny 10 mg/l a přetrvává v terapeutické sérové hladině nad 2 mg/l po cca 40 % dávkovacího intervalu, ve sputu a bronchiální mukóze o něco déle. Výhodnější perorální variantou cefalosporinu 2. generace

je **cefprozil**, jehož vstřebávání je nezávislé na jídle a biologická dostupnost až dvakrát vyšší.

Kotrimoxazol (trimetoprim-sulfametoxazol) má biologickou dostupnost 85 % a je vhodným přípravkem pro SAT. Úvodní nitrožilní aplikace by měla být převedena na perorální podávání hned, jak je to možné. Parenterální léčba je zpočátku nezbytná při nemožnosti perorálního příjmu, ale také u závažných infekcí vyžadujících vysoké dávky: např. u pneumocystové pneumonie u pacientů s AIDS a u jiných imunokompromitovaných osob (s dávkou 15–20 mg/kg/den trimetoprimové komponenty) nebo u závažných infekcí vyvolaných *Stenotrophomonas maltophilia* (15 mg/kg/den). Tabletová forma se obvykle dává 960 mg každých 12 hodin, ale pacienti tolerují i vyšší dávky. U pacientů s renální insuficiencí či na terapii léky zvyšujícími hladinu draslíku je riziko vzniku hyperkalémie, a to zejména při déle trvající léčbě kotrimoxazolem nebo při použití vyšších dávek. V takovém případě je nutné kontrolovat i krevní obraz pro možnou hematotoxicitu.

Biologická dostupnost **klindamycinu** je 90 %. Použití pro SAT doložily observační studie a rozsáhlá klinická zkušenost, zejména u infekcí ve stomatologii, ORL, při postižení kůže a měkkých částí, kostí, u ranných infekcí, v břišní chirurgii a u infekcí diabetické nohy. Maximální perorální dávka je omezena gastrointestinální tolerancí a nepřesahuje 1800 mg denně.

Doxycyklin je v současnosti používán zejména k léčbě sexuálně přenosných infekcí (způsobených *Chlamydia trachomatis*, u syfilis

Tab. 2. Parenterální antiinfektiva s možnými alternativami pro perorální podávání

i. v. léčivo	dávkování i. v.	p. o. léčivo	biologická dostupnost	dávkování p. o.
penicilin G	4x 5–10 mil. j.	penicilin V	60–70 %	1,2–1,5 mil.j. 3–4x denně #
ampicilin	4x 1–3 g	amoxicilin	75–90 %	3x 500 mg až 4x 1 g
oxacilin	4x 2 g až 6x 2 g	flukloxacilin	55–80 %	3x 500 mg až 1 g #
flukloxacilin	4x 2 g			
amoxicilin-klavulanát	3x 1,2 g	amoxicilin-klavulanát	80 %	2x 1 g, 3x 625 mg, 3x 1 g
ampicilin-sulbaktam	3x 1,5 g až 4x 3 g	ampicilin-sulbaktam	80 %	2x 750–1500 mg
piperacilin-tazobaktam	3x 4,5 g až 4x 4,5 g	amoxicilin-klavulanát	80 %	2x1 g, 3x 625 mg, 3x 1 g
cefazolin	4x 1 g	cefadroxil	90–95 %	2x 500 mg až 3x 1 g
cefuroxim	3x 1,5 g	cefuroxim-axetil	40–50 %	2x 500 mg ##
		cefprozil	95 %	2x 500 mg
ceftriaxon	2x 2 g	cefprozil	95 %	2x 500 mg
cefotaxim	3x 2 g	cefprozil	95 %	2x 500 mg
ceftazidim	3x 2 g	ciprofloxacin	70 %	2x 750 mg
ciprofloxacin	2x 400 mg	ciprofloxacin	70 %	2x 500 mg až 750 mg
levofloxacin	2x 500 mg	levofloxacin	přes 95 %	2x 500 mg
moxifloxacin	1x 400 mg	moxifloxacin	86 %	1x 400 mg
klindamycin	3x 600 mg až 4x 1,2 g	klindamycin	90 %	3x 300–600 mg
azitromycin	1x 500 mg	azitromycin	37 %	500 mg #
klaritromycin	2x 500 mg	klaritromycin	55 %	2x 500 mg
kotrimoxazol	2x 960 mg	kotrimoxazol	85 %	2x 960 mg až 1440 mg
linezolid	2x 600 mg	linezolid	100 %	2x 600 mg
—	—	doxycyklin	90 %	2x 100 mg, 3x 100 mg, 2x 200 mg ##
metronidazol	3–4x 500 mg	metronidazol	80–90 %	3x 500 mg
rifampicin	1x 600 mg	rifampicin	90 %	2x 300 mg nebo 1x 600 mg #
flukonazol	2x 400 mg	flukonazol	90 %	1–2x 100 mg
vorikonazol	2x 4 mg/kg*	vorikonazol	96 %	2x 200 mg* #

(Pozn.: uvedené dávkování je orientační, vždy je třeba zohlednit SPC léčiva, aktuální klinickou situaci a charakteristiky pacienta, včetně případné renální insuficience (4,7))

* první den nasyčovací dávka 2 x 6 mg/kg i. v. resp. 2 x 400 mg p. o.; # užívat nalačno; ## užívat po jídle