

β-lactam Antibiotics

Penicillins

تشتغل على gram-positive bacteria لأن يحتوي ع cell wall اكبر

Natural antimicrobial

- penicillin
- cephalosporins
- monobactams
- carbapenems

penicillins were the first antibiotics to be discovered

- most effective أكثر فاعليه
- least toxic. اقل سميه

Penicillins can be grouped according to their antimicrobial activity.

Narrow-spectrum penicillins

- penicillin G (benzyl penicillin) IV form
- penicillin V oral form
- Penicillinase-resistant penicillins dicloxacillin, nafcillin

Extended-spectrum penicillins

- antipseudomonal penicillins piperacillin, ticarcillin
- aminopenicillins amoxicillin, ampicillin

staphylococcal

البيّنسيلين الذي يقاوم
β-lactamase تقاوم ال penicillin لأن رح تغرز انزيم اسمه
Penicillinase-resistant penicillins ف هاي المجموعه من ادويه
β-lactamase رح تقاوم هذا انزيم

β-lactamase = penicillinase

aminopenicillins... ركزوا

الفائدة من هاي amine علمود تسمح للبيّنسيلين بالمرور من

Porins التي هي قنوات موجوده ب outer membrane مال gram-negative bacteria

يعني بين قوسين ال aminopenicillins تشتغل ضد gram-negative bacteria

مهم

Penicillin G and penicillin V are the only natural penicillins antibiotics and they are classified as narrow-spectrum drugs.

R chain اللعبة والفكره في ب

من غير ب R chain.. انتج انواع مختلفه من بينسيلين



معلومه مو مهمه
تركيب مال بينسيلين هو

The penicillinase-resistant penicillins have a large R group that protects them from hydrolysis by staphylococcal penicillinase

تفكك مال

β-lactamase

R chain

يقصد تحمي البيّنسيلين التي تحمي

narrow-spectrum penicillins:

1 – Penicillin V;

oral form of penicillin, only in minor infections, the need for dosing four times a day,

Amoxicillin is often used instead بدلا منه

aminopenicillins

بينزال بنسيلين

2 – Penicillin G (benzylpenicillin) ;

has activity against a variety of 

القوة

potency of penicillin G is five to ten times greater than penicillin V against both *Neisseria* spp. and *anaerobes*

ضد

Most streptococci are very sensitive to penicillin G

تتأثر / تتأثر / تتأثر

viridans streptococci and *Streptococcus pneumoniae*

يقاومون

Are resistant to penicillin G

Staphylococcus aureus Also Are resistant to penicillin G

Penicillin G is drug of choice for the treatment of

1–gas gangrene (*Clostridium perfringens*)

2–syphilis (*Treponema pallidum*).

3 – penicillinase-resistant penicillins

(Antistaphylococcal penicillins) اسمه ثاني

dicloxacillin

nafcillin

flucloxacillin

oxacillin

β -lactamase *staphylococcus* لان ال هي اكثر وحده تنتج

These drug developed to treat penicillin-resistant strains of *staphylococci*.

سلالات

These penicillins are not active against most other species of penicillinase-producing bacteria

يعني تعالج فقط *staphylococcus* المقاومة.. واي انواع مال بكتريا المقاومة اخرى ما تعالجه

Nafcillin is parenteral administration IV + IM

dicloxacillin can be given orally

Flucloxacillin can be administered by both

penicillinase-resistant drugs are used to treat serious staphylococcal infections, such as acute endocarditis and osteomyelitis, as well as skin

penicillinase-resistant penicillins ومع ذلك اكو اصناف من *staphylococcus* تقاوم

methicillin-resistant *Staphylococcus aureus* (MRSA)

اسمه

extended-spectrum penicillins :

1 – aminopenicillins (amoxicillin and ampicillin)

2 – antipseudomonal penicillins (piperacillin and ticarcillin)

aminopenicillins

aminopenicillins have greater activity against Gram negative

Haemophilus influenzae *H. influenzae*

Escherichia coli *E. coli*

Proteus mirabilis

enterococci

اخذنا بالميكرو بحيث كلت اي بكتريا بالامعاء تكون

Gram negative

والسبب حجبنا قبل شويه... لان رح تختري outer membrane عن طريق porins

Amoxicillin ٧.٥. ampicillin

امتصاصه من gut هواي

امتصاصه من gut قليل

ولهذا سبب هذا مرح يمتص من امعاء (يبقى بداخل امعاء)
ف يعالج البكتيريا التي تصيب الامعاء

Bioavailability more

ولهذا السبب ناخذ بجرعات قليله

Bioavailability less

ولهذا السبب ناخذ بجرعات عاليه

Amoxicillin and ampicillin are often combined with a β -lactamase inhibitor
عباره عن ادويه تقتل β -lactamase يعني رح تبقى β -lactam drug عايشه

لان منعنا (وقفنا / كسرنا) β -lactamase

β -lactamase inhibitor
sulbactam
clavulanate (Augmentin)
tazobactam



amoxicillin with clavulanate (Augmentin)

ampicillin with sulbactam

الشغل تزيد

β -lactamase inhibitor extends the activity of these penicillins

اكيد لان رح تقتل انزيم الذي يكسرها
 β -lactamase

aminopenicillins+ β -lactamase inhibitor

Use for

1 – Staphylococcus aureus

2 – β -lactamase-producing Gram-negative bacteria

Gram – β -lactamase تنتج اخبط وياه β -lactamase inhibitor
Staphylococcus aureus تكون (MRSA) يعني مفيد
وبالنسبه لل Staphylococcus aureus

aminopenicillins+ β -lactamase inhibitor ف لازم انطي خليط من

Amoxicillin can be used alone to treat respiratory tract infections including
otitis media, sinusitis, bronchitis

جيوب انفيه التهاب اذن الوسط

Amoxicillin-clavulanate is also indicated for treating bite wound infections

Amoxicillin alone is used for prophylaxis of bacterial endocarditis in persons
with heart valve defects.

Ampicillin is against Listeria monocytogenes+diabetic foot ulcers

Ampicillin (but not amoxicillin) is effective for shigellosis.

antipseudomonal penicillins
piperacillin
ticarcillin

✓ Against Pseudomonas aeruginosa

Pharmacokinetics

amoxicillin, dicloxacillin, and penicillin V, are given orally

Penicillin G, ampicillin, piperacillin, tazobactam, nafcillin and oxacillin must be administered intravenously (IV) or intramuscularly (IM).

Penicillin G have long-acting forms (Depot forms) for intramuscular administration, **IM**

بينسيلين G بي خاصيه من نضربه بالعضله رح يبقى بداخل عضله وشويه شويه يروح ع دم (يعني احسن من انطي IV وبسرعه يخلص half life ولازم انطي اكثر من جرعه باليوم..) اضر به IM كل شهر

هاي خاصيه تفيدني من شخص ينصاب **β -hemolytic streptococcal pharyngitis**

لان اكيد شخص من ينصاب بهاي بكتريا... ورا شهر او اسبوعين **يصير عنده** rheumatic fever and rheumatic heart disease. ويفضل هذا العلاج يضل لفترة طويله بالجسم مو مال انطي يوميه جرعه ف اني قبل انطي علاج علمود امنع يصير عنده **rheumatic fever**

Food decreases the absorption of all the penicillinase-resistant penicillins

drugs are destroyed by stomach acid. Therefore, they should be taken on an empty stomach.

amoxicillin is stable in acid عادي اخذه باي وقت

معلومه معيوده لكن مهمه... بينسيلين ما يخترق BBB يعني ميروح ع CNS.. الا بحاله وحده رح يعبر BBB.. الي هي meningitis

كل ادويه تطلع من جسم عن طريق kidney عدا Nafcillin and oxacillin يطلعون عن طريق bile

معلومه كلش مهمه.. اكو دواء اسمه **probenecid** يعالج gout.. لان رح يطلع uric acid بس بي شغله وحده.. رح يمنع خروج بينسيلين من kidney... يعني رح يبغي بينسيلين بالجسم هواي وهاي صراحه تفيدني علمود انطي بينسيلين جرعه وحده باليوم.. ما اضل كلسع انطي جوعات هواي باليوم

Adverse Effects

drug-induced hypersensitivity reactions حساسيه من بينسيلين

ranging from rashes to angioedema (marked swelling of the lips, tongue, and periorbital area) and anaphylaxis

Cross-allergic reactions occur among the β -lactam antibiotics.

حساسيه من اي دواء يحتوي ع **β -lactam** ف رح يسوي حساسيه لجميع ادويه التي تحتوي ع **β -lactam**

يتحطم

reactions occur when penicillin is degraded to penicilloic acid and other compounds that combine with body proteins to form antigens that elicit antibody formation يحفز تتحد لتكوين

يعني البينسيلين ميسوي حساسيه لكن النواتج ايشيه ماله تسوي حساسيه

تهيج

High concentrations of penicillins can be irritating to the central nervous system and elicit seizures in patients who have received very large doses of these drugs due to the ability of penicillins to cause GABA inhibition.

penicillins can disturb the normal flora of the gut and produce diarrhea
penicillin-resistant organisms, such as staphylococci and Clostridium difficile.

لأن البنسلين رح يقتل نورمل فلورا ويبقي بكتريات التي تقاوم بينسلين مثل staphylococci and Clostridium difficile
ف الملعب (gut) رح يضل بس لل staphylococci and Clostridium difficile ورح يسون انفكش (بس همه بالاصل نورمل فلورا)

Pseudomembranous colitis can occur in association with C. difficile

Clostridium difficile

همين هي نورمل فلورا بس من ناخذ انسولين ... رح تموت كل نورمل فلورا عدا هاي ورح تبقى وحده وتسوي
Pseudomembranous colitis