

**訂正：前回の④の訂正：ソルデム 3AG は K 濃度 17.5mEq/500mL ではなく 10mEq/500mL です。 よってソルデム 3AG+アス K 1 筒で 40mEq/L。 昔使った EL-3 号とソルデム 3AG を取り違えました。**

## 新規抗生剤

2016.1

新規抗生物質の開発はラクタム環の改良が主で、新しいクラスの抗生剤は 35 年ぶり。 **ストレプトグラミン**：農薬に使われていた。 **キヌプリスチン**：**ダルホプリスチン**の 3：7

(重量比) 混合物で単独では静菌的だが混合物は殺菌的に作用する。 細菌の 50S (スベドベリ) リボゾームに結合しペプチド合成を阻害(真核生物のリボゾームは 40S と 60S)。

**シナシッド®** (2003 年 承認) MRSA、エンテロコッカス・フェカリス *Enterococcus faecalis* とエンテロコッカス・フェシウム *Enterococcus faecium* などバンコマイシン

耐性腸球菌に有効。 なぜ殺菌的に働くかなど不明

な点が多い。 **環状リポペプチド**：**ダプトマイシン**、私が研究室にいた頃はイオノフォア (イオン孔を造る抗生剤) と呼ばれ、心筋細胞の壁に穴を開けて

$\text{Ca}^{++}$ を流入させる強心剤として開発 ( $\text{Ca}^{++}$ 入りすぎ

で心筋壊死!)。 浸透性が強いので、血管内留置カテ、人工生体弁、人工関節などに感染してバイオフィルムを作る MRSA、MRSE、 $\beta$  溶血性連鎖球菌、 $\alpha$  連鎖球菌、バンコマイシン耐性腸球菌などグラム陽性菌に有効。  $\beta$  ラクタム環と異なり細胞内に入るので、アミノグリコシド同様の **Post Antibiotic Effect** (PAE:抗生剤後効果、血中濃度が下っても 6 時間有効) がみられる。 **キュビシン®** 2011 年承認。 MIC は  $0.5 \mu\text{g/ml}$  と低いが肺胞のサーファクタント・プロテインで不活性化されるので肺炎には使えない。

HMG-CoA と併用すると筋障害。 **第 5 世代セファロsporin**： Ceftobiprole、

Ceftaroline fosamil (2010 年 FDA 認可) セフトリアキソン+グラム陽性球菌スペクトラムといったところ? 第 5 世代は日本未承認。**PBP2'にも親和性を持つので MRSA、**

**VISA、グラム陰性菌、 $\beta$ ラクタマーゼにも有効。** **Fidaxomicin (フィ**

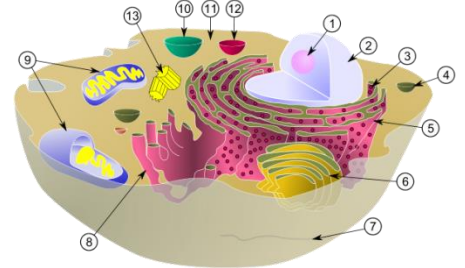
**ダキソマイシン)**：クロストリジウム・デフィシルによる偽膜性大腸菌にはメトロニダゾール、経口バンコマイシンが有効だが、フィダキソマイシンは有効、かつ再発が少ないマクロライド系抗生剤。 FDA

は 2011 年認可、日本では審査中。 **ポリコナゾール**：アゾール系抗真菌薬、カンジダに対する効果は、フルコナゾール (ジフルカン) より強い。また、侵襲性アスペルギルス症 (侵襲性とは表在性ではない、

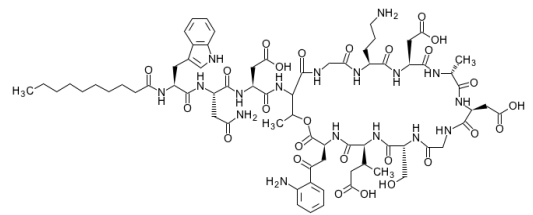
血行を感染した病巣を持つ状態) に対しては、アムホテリシン B (ファンギゾン)、ミカファカンギン (ファンガード) を上回る有効率と生存率。 **ブイフェンド®** (2005 年

承認、経口薬 2014 年承認)。 エルゴステロール合成阻害剤 (フルコナゾール、アムホテリシン B と同様)。 真菌は動植物と異なり厚いキチン質を含む細胞壁をもつ。

細胞壁の下は細胞膜はヒトでは**コレステロール**であるが真菌は**エルゴステロール**。 侵襲型 (血流を介して感染:表在型でない) アスペルギルスにはジフルカンほとんど無効。



②細菌では核はない ③リボゾーム (ポツポツ付いている) ⑤粗面小胞体 ⑨ゴルジ体 ⑨ミトコンドリア



C12013

