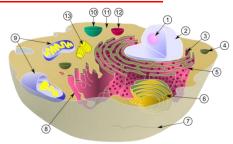


新規抗生剤

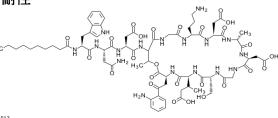
https://l-hospitalier.github.io

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 faeciumn などバンコマイシン耐性



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



#25

入りすぎて心筋壊死!)。 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、 β 溶血性連鎖球菌、 α 連鎖球菌、 α 連鎖球菌、 α がない。 β 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 μ 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 世代セファロスポリン: 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、 β 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。 ボリコナゾール (右図):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

H₃C OH N

(ファンガード®)を上回る有効率と生存率。 商品名はブイフェンド® (2005 年承認、経口薬 2014 年承認)。 他に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。 細胞壁の下の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。