

Beta-lactam계 항생제 및 세포벽 합성 억제제

이종호

한림의대 약리학교실

Beta-lactam계 항생제 및 세포벽 합성 억제제

I. Overview

II. Penicillins

III. Cephalosporins

IV. Other beta-lactam drugs

V. Other inhibitors of cell wall synthesis

Beta-lactam계 항생제 및 세포벽 합성 억제제

I. Overview

II. Penicillins

- III. A. 분류 ins
- IV. B. 작용기전 actam drugs
- V. C. 내성 inhibitors of cell wall synthesis
- D. 약동학
- E. 임상적 사용
- F. 부작용

작용 기전

- Bactericidal
- Only effective against rapidly growing bacteria
- 작용기전
 - Penicillin-binding proteins
 - Methicillin-resistant *S aureus*(MRSA)
 - Inhibition of transpeptidase
 - Production of autolysins

Resistance

- Natural
 - no peptidoglycan cell wall
 - mycoplasma
 - Impermeable cell wall
- Acquired
 - Beta-lactamases
 - Altered PBPs
 - Decreased permeability
 - Efflux pump
 - Impaired penetration of drug to target PBPs

Hypersensitivity

- All penicillins are cross reacting
- 발생률
 - Penicillin hypersensitivity 기왕력; 전체의 5-8%
 - 그중 5-10%만 과민반응 발생
 - Penicillin hypersensitivity 기왕력 없던 사람; 1% 미만에서 과민반응 발생
- 종류
 - Immediate hypersensitivity(20분)
 - Anaphylactic shock; 0.05%
 - Minor determinants; penicillin, penicilloate
 - IgE mediated
 - 치료; epinephrine
 - Accelerated(1일), delayed(1주) hypersensitivity
 - Major determinants; penicilloyl moiety
 - IgG, IgM mediated
 - Skin rashes

Beta-lactam계 항생제 및 세포벽 합성 억제제

I. Overview

II. Penicillins

III. Cephalosporins

IV. A. 분류

actam drugs

V. B. 작용기전

ors of cell wall synthesis

C. 내성

D. 약동학

E. 임상적 사용

F. 부작용

Cephalosporins

- Penicillin과 유사점
 - 작용기전
 - Inhibition of transpeptidases
 - 배설기전
 - Active tubular secretion
 - 부작용
 - Some cross hypersensitivity with the penicillins
 - Superinfection
 - Nephrotoxicity
- Penicillin과 다른점
 - Broader spectrum
 - More resistant to beta-lactamases
 - Most are ineffective when taken orally

Beta-lactam계 항생제 및 세포벽 합성 억제제

- I. Overview
- II. Penicillins
- III. Cephalosporins
- IV. Other beta-lactam drugs
- V. A. Aztreonam
B. Imipenem & meropenem
C. Beta-lactamase inhibitors vall synthesis

Aztreonam

- A monobactam
- Bactericidal
- 항균범위
 - Aerobic gram(-); *Pseudomonas*
- Resistant to beta-lactamase
- Parenteral administration

Imipenem

- A carbapenem
- Bactericidal
- 항균범위
 - Very broad
 - 특히 *Campylobacter fetus, Serratia* 감염증 치료에 유효함.
- Resistant to beta-lactamase
- Nephrotoxic
 - Metabolites by renal dehydropeptidases; nephrotoxic
 - **Cilastin** inhibits the dehydropeptidases
 - Imipenem + cilastin

Beta-lactamase inhibitors

- Indications
 - 경험요법
 - 면역저하 환자
 - 혼합감염(intra-abdominal infections)

Beta-lactam계 항생제 및 세포벽 합성 억제제

- I. Overview
- II. Penicillins
- III. Cephalosporins
- IV. Other beta-lactam drugs
- V. Other inhibitors of cell wall synthesis
 - A. Vancomycin
 - B. Fosfomycin
 - C. Bacitracin
 - D. Cycloserine

Vancomycin

- A tricyclic glycopeptide
- Bactericidal
- 작용기전
 - Peptidoglycan pentapeptide side chain의 D-Ala-D-Ala terminal에 결합하여 transglycosylation을 억제한다.

기타 세포벽합성 억제제

- Bacitracin
 - Mixture of polypeptides
 - Antibiotic spectrum
 - Gram(+) bacteria
 - 신장 독성으로 국소적으로만 사용
- Fosfomycin
 - 요로감염증의 이차선택약
- Cycloserine
 - 결핵의 이차선택약