タンパク質合成阻害

アミノグリコシド系抗菌薬

名前の共通性
○○○マイシン、○○○シン

原核生物のリボソームに作用（コドンの誤読、合成阻害）　しかし　毒性が高い　→　TDM

殺菌的に作用　濃度依存的に効果を発揮

βラクタム系との併用で相乗効果あり

腎排泄型

副作用：腎毒性、第八脳神経障害（難聴、平行障害）

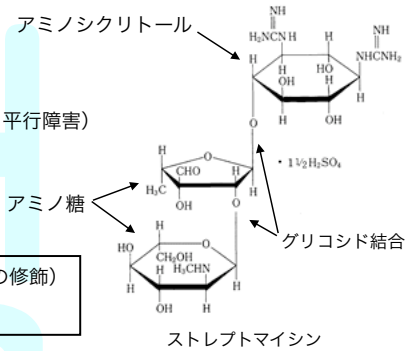
増強
ループ系利尿薬やバンコマイシンの併用

- ストレプトマイシン　結核治療薬の第１選択薬の１つ
- カナマイシン　結核治療薬の第2選択薬の１つ
- アルベカシン　抗MRSA薬の１つ

耐性機構

アセチル化、リン酸化、アデニル化　（←薬剤の修飾）

リボソームの変異（←薬剤標的の変化）



ストレプトマイシン

マクロライド系抗菌薬

名前の共通性
○○○マイシン　苦味がある→シロップと混ぜる

グラム陰性菌には大型なためにの外膜のポーリンを通過できず無効

リボソームの50sサブユニットに結合 → タンパク質合成阻害　細胞壁が無い菌=βラクタム系無効

副作用が非常に少ない　→　小児にも利用可　（小児のマイコプラズマ肺炎の第一選択薬）

代謝産物がP450-CYP3A4を阻害　→　併用薬の血中濃度が上昇←注意必要

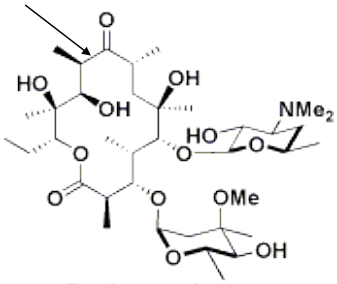
時間依存的に作用　静菌的に作用する

慢性気道感染症（びまん性汎細気管支炎、慢性副鼻腔炎（蓄膿症）の治療
1/2量を6〜24ヶ月投与（長期少量投与療法）

- 14員環マクロライド　(髄液移行は悪い)
  - エリスロマイシン　脂溶性→細胞内移行性が高い　肺への移行性高い
  - クラリスロマイシン　ピロリ菌の除菌
  - ロキシスロマイシン
- 15員環マクロライド　商品名；ジスロマック
  - アジスロマイシン　インフルエンザ菌、クラミジアに使用、半減期が長い（68時間）→3日投与で7日効果持続（ローディングドーズ）
- 16員環マクロライド　キタサマイシン、ジョサマイシン、ロキタマイシン、ミデカマイシン、スピラマイシン

マイコプラズマ肺炎
レジオネラ肺炎 ― 細胞内寄生菌
クラミジア
ジフテリア
百日咳

大環状＿＿＿＿＿＿骨格


Erythromycin

耐性機構
リボソームの変異（←薬剤標的の変化）

テトラサイクリン系抗菌薬

名前の共通性
○○○サイクリン　テトラサイクリン、ミノサイクリン、ドキソサイクリン

リボソームの30Sサブユニットに結合 → リボゾームにアミノアシルtRNAが結合するのを阻害　←　静菌的に作用

広域抗生物質　→　菌交代症

グラム陽性菌、グラム陰性菌（緑膿菌を除く）に有効　特にクラミジア感染症、リケッチア感染症、マイコプラズマ肺炎に用いられる

金属イオン**とキレート形成→吸収されない**

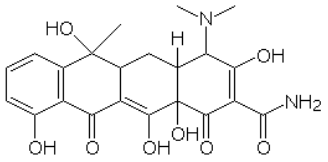
制酸剤・胃腸薬（pH上昇、Al^{3+}、Mg^{2+}）

牛乳（Ca^{2+}）、鉄剤との同時服用はダメ

2時間あける

副作用：歯牙黄染　Caとキレートを形成するため骨や歯が黄色くなる。特に発達段階の乳幼児や小児には使用を避ける。

耐性機構：テトラサイクリン排出ポンプ


テトラサイクリン

4個の六員環が結合した構造を持つ**黄色**い薬剤

クロラムフェニコール系抗菌薬

クロラムフェニコール

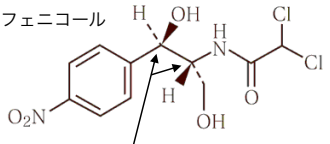
リボソームの50Sサブユニットに結合　→　ペプチジルトランスフェラーゼ (ペプチド転移反応) を阻害

グラム陽性、陰性にかかわらず、多くの微生物に対して有効　←静菌的に作用する

副作用：再生不良性貧血、グレー症候群
重大な副作用である　→　腸チフスなど重大で生命の危機がある感染症にのみ用いられる

耐性機構：クロラムフェニコールアセチルトランスフェラーゼ = CAT（クロラムフェニコールをアセチル化する）

クロラムフェニコール



分子内に2個の不斉炭素を持ち、4つの光学異性体があるが、抗菌活性があるのはそのうちの1つである。
全合成可能。

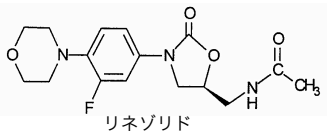
オキサゾリジノン系抗菌薬

リネゾリド

リボゾームの50sサブユニットと30sサブユニットとmRNAが複合体を形成するのを阻害する。

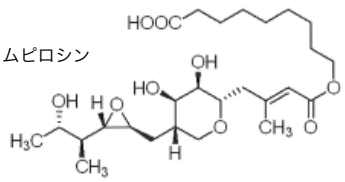
抗VRE薬、抗MRSA薬　耐性機構　リボゾームの変異（←薬剤標的の変化）

経口吸収が非常に高い　バイオアベイラビリティが100%に近い


リネゾリド

ムピロシン

ムピロシン



イソロイシル-tRNA合成酵素阻害　→　イソロイシル-tRNAができない→翻訳が途中で終わってしまう。

鼻腔内のMRSAの除菌に用いられる　←　商品名；バクトロバン難航