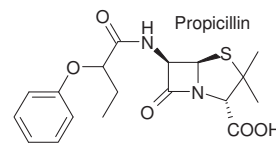
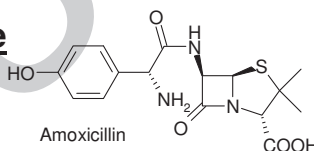


3.2.2 β -Lactam-Antibiotika - Penicilline

3.2.2 β -Lactam-Antibiotika – Penicilline



	Penicillin G	Oralpenicilline	Isoxazolyl-p.	Amino-p.	Acylamino-p.
<u>WM</u>	Hemmung der Transpeptidase als D-Ala-D-Ala-Analogen → bakterizid auf proliferierende Keime				
<u>Substanzen</u>	Penicillin G	Penicillin V, Propicillin, Azidocillin	Oxacillin, Dicloxacillin, Flucloxacillin	Ampicillin, Amoxicillin	Mezlocillin, Azlocillin, Piperacillin
<u>Wirk- spektrum</u>	Streptomyceten, Pneumokokken	Streptomyceten, Pneumokokken	(β -Lactamase bildende) Staphylokokken	Erweiterung auf gram-	Erweiterung auf P. aeruginosa
<u>Pharmako- kinetik</u>	Nicht säurestabil → nur parenteral HWZ = 30-40min	Säurestabil → p.o. HWZ < 1h	Säurestabil, penicillinasefest HWZ = 30- 60min	Säurestabil Ampicillin nur i.v. <-> Amoxicillin p.o.	Nicht säurestabil → parenteral HWZ ca. 1h
	Geringe Durchdringung von Zellbarrieren → geringe Konzentration in Liquor u.a. Kompartimenten (! bei entzündlichen Prozessen leichtere Diffusion)				
<u>β- Lactamase- Stabilität</u>	nein	nein	ja	Nein → Kombi mit β - Lactamase- Inhibitoren	Nein → Kombi mit β - Lactamase- Inhibitoren
<u>NW</u>	Allergische Reaktionen (v.a. bei parenteraler Applikation: leichte Hautreaktion bis anaphylaktischer Schock; Erstkontakt evtl. auch durch Schimmelpilze/Nahrungsmittel), Beeinflussung des GIT, Neurotoxizität, Hämostase-Störungen , evtl. Krämpfe				
<u>WW</u>	Synergismus mit Aminoglykosiden, Resistenz/Kreuzresistenz möglich				

3.2.3 β -Lactamase-Inhibitoren

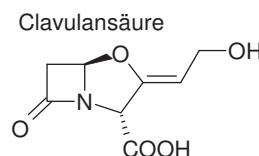
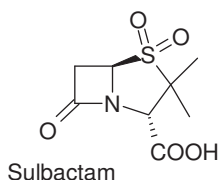
3.2.3 β -Lactamase-Inhibitoren

WM: β -Lactamasen öffnen Lactamring \rightarrow irreversible Bindung \rightarrow Inaktivierung

(**Suizid-Inhibitoren**)

- \rightarrow Moleküle mit keiner/schwacher antibakterieller Aktivität, aber hohe Affinität zu β -Lactamasen
- \rightarrow bei gleichzeitiger Gabe von Antibiotikum + Hemmstoff: „Konkurrenz“ um Bindung an β -Lactamase

Substanzen: Sulbactam, Tazobactam, Clavulansäure



Sultamicillin (= β -Lactamase-Inhibitor + AB in 1 Molekül \rightarrow Spaltung im Organismus)

Indikationen: Einsatz nur zusammen mit Antibiotikum

\rightarrow **feste Kombinationen mit β -Lactamase-Inhibitoren:**

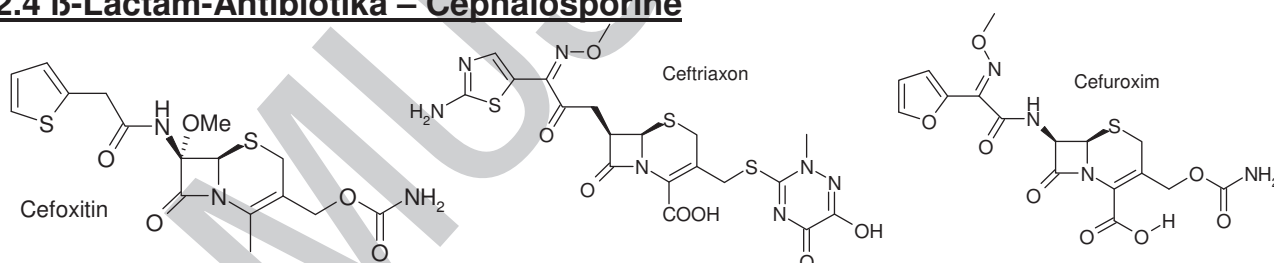
Clavulansäure + Amoxicillin \rightarrow Spektrumerweiterung auf β -Lactamase-produzierende Stämme

Sulbactam + Ampicillin \rightarrow parenteral oder p.o.

Tazobactam + Piperacillin \rightarrow ausschließlich parenteral

3.2.4 β -Lactam-Antibiotika - Cephalosporine

3.2.4 β -Lactam-Antibiotika – Cephalosporine



	Gruppe 1	Gruppe 2	Gruppe 3	Gruppe 4	Gruppe 5
<u>WM</u>	Hemmung der Transpeptidase als D-Ala-D-Ala-Analogen → bakterizid auf proliferierende Keime				
<u>Substanzen</u>	Oral: Cefaclor, Cefadroxil Parenteral: Cefazolin	Oral: Loracarbef Parenteral: Cefuroxim, Cefotiam	Oral: Cefixim, Ceftibuten Parenteral: Ceftriaxon	Cefepim	Cefoxitin
<u>Wirkspektrum</u>	Von Gruppe 1 (gut gegen gram+) zu Gruppe 5 bessere Aktivität gegen gram- (Gr. 5 auch gegen anaerobe Keime); ! Enterokokken-Lücke!				
<u>Pharmako-kinetik</u>	Verteilung nur extrazellulär, niedrige Liquorkonzentration fast alle renal eliminiert, HWZ 1-2h außer Ceftriaxon: 8h				
<u>β-Lactamase-Stabilität</u>	ja (gram+)	Ja (gram+/gram-)	Ja (gram-)		
<u>NW</u>	Allergische Reaktionen (v.a. bei parenteraler Applikation: leichte Hautreaktion bis anaphylaktischer Schock; Erstkontakt evtl. auch durch Schimmelpilze/Nahrungsmittel), Beeinflussung des GIT, Neurotoxizität, Hämostase-Störungen , evtl. Krämpfe				
<u>WW</u>	Synergismus mit Aminoglykosiden, Resistenz/Kreuzresistenz möglich				

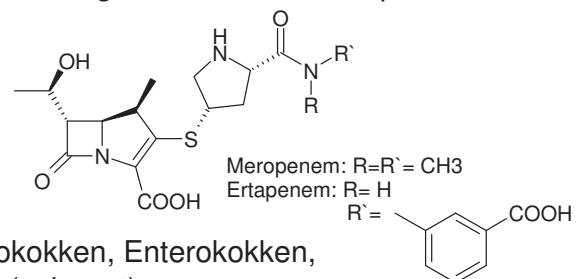
3.2.5 β -Lactam-Antibiotika - Carbapeneme

3.2.6 β -Lactam-Antibiotika - Monobactame

3.2.5 β -Lactam-Antibiotika - Carbapeneme

WM: **Hemmung der Transpeptidase** als D-Ala-D-Ala-Analogon \rightarrow bakterizid auf proliferierende Keime

Substanzen: Imipenem, Meropenem, Ertapenem



Wirkspektrum: aerobe + anaerobe Bakterien: Streptokokken, Enterokokken, Staphylokokken, Enterobacteriaceae (sehr gut)

Pharmakokinetik: **keine enterale Resorption** \rightarrow i.v., β -Lactamase-resistent

Inaktivierung von Imipenem durch renal-tubuläre Dehydropeptidase

(\rightarrow Hemmstoff Cilastatin) \leftrightarrow Meropenem/Ertapenem nicht abgebaut (auch gegen Imipenem-resistente Pseudomonas aeruginosa)

Indikationen: Infektionen der unteren Atemwege, Harnwege, Haut- und Gelenkinfektionen

! Einsatz nur restriktiv !

NW: wie Penicilline und Cephalosporine

3.2.6 β -Lactam-Antibiotika – Monobactame

WM: **Hemmung der Transpeptidase** als D-Ala-D-Ala-Analogon \rightarrow Bakterizid auf proliferierende Keime

Substanz: Aztreonam

Wirkspektrum: **nur gegen gram- Aerobier** (sehr gut gegen Enterobakterien)

Pharmakokinetik: nur parenteral, da keine Resorption aus dem GIT
 β -Lactamase-resistent; fast unverändert eliminiert

NW: wie Penicilline und Cephalosporine

