

# 건유기 유방염 예방치료제 -세파렉신PC 연고-

## 1. 개요

Fleming에 의해 1929년 페니실린 (penicillin) 이 발견되고 Brotzy에 의해 1945년 세팔로스포린 (Cephalosporin) 이 발견되어 페니실린의 단점을 보완하면서 실로  $\beta$ -락탐계의 역할은 인류의 질병 퇴치에 큰 공헌을 해왔다. 이 중 세팔로스포린계는 반 이상을 차지할 정도로 큰 역할을 하고 있는데(그림1 참조)경제적인 문제로 동물 약품계에서 주저해 오다가 근래들어 일부 제품이 시판되기 시작하여 양축가의 반응을 타진하고 있다.

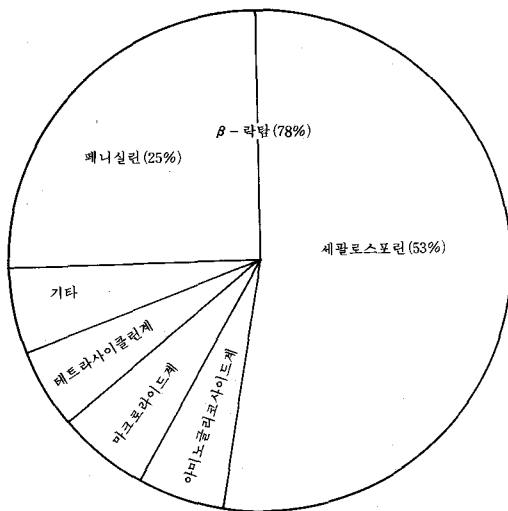


그림 1. 항생제의 구성비

세팔로스포린계는 '60년대 부터 본격적으로 개발되기 시작, 현재 4세대까지 진행중에 있으며(시대와 개발 방향 등에 따라 분류) 최근 페니실린이나 세팔로스포린의 치아졸 또는 치아

진 핵 대신 옥사졸 또는 옥사진 핵으로 대체된 옥사세페미계 유도체가  $\beta$ -Lactamase에 더욱 안정하다고 판명되어 이 계통으로 연구 개발이 진행되고 있다(세팔로스포린계의 기원, 구조, 작용기전, 세대구분 등에 대해서는 '87 3월호 제일화학편을 참조하기 바람). 어쨌든 유방염의 감염율이 준임상형까지 포함해서 반 이상인 축산 낙농의 현 시점에 있어서 주요 유방염 원인균에 감수성이 높은 세팔로스포린계의 대두는  $\beta$ -Lactamase에 안정하고 내성발현 문제가 없다는 점에서 큰 활로를 터줄 것으로 보며 이러한 배경하에서 본사 세파렉신 DC가 개발되었는바 본란에서는 이에 대한 제반적인 것을 소개하고자 한다.

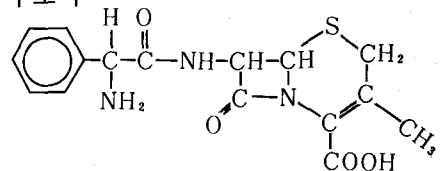
## 2. 세파렉신 (Cephalexin) 의 이화학적 특성

세파렉신은 곰팡이인 Cephalosporium acremonium에 의해서 산생된 천연 항생제 Cephalosporin - C로부터 유도된 반합성 항생제이다.

### 1) 화학명

7 - (D -  $\alpha$  - amino -  $\alpha$  - phenylacetamido) - 3 - methyl - 3 - cephem - 4 - carboxylic acid.

### 2) 구조식



### 3) 안전성 (Stability)

물에 비교적 낮은 용해도를 가져 37°C 1ml에

1~2 mg이 녹고 pH 2~8에서의 용해도는 1 ml당 120~100mg이다. pH4.5에서 가장 안전하다.

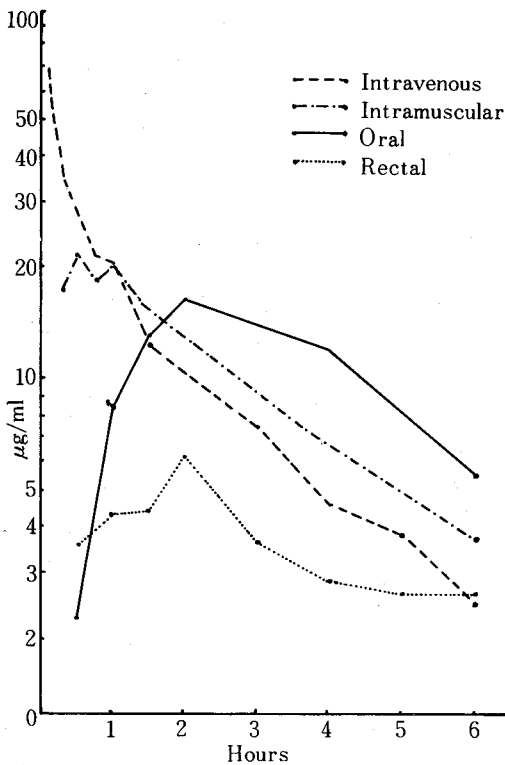
#### 4) 안정성 (Safety)

\* 급성 독성

품종	경구독성 (LD <sub>50</sub> )	비경구독성 (LD <sub>50</sub> )
	g/kg	g/kg
Mouse	1.6~4.5	0.4~1.3
Rat	>5.0	>3.7
젓펜 것	>4.0	
신생아	>3.0	
Rabbit		>4.0
Cat	>0.5	>1.0
Dog	>0.5	>0.5 1.0
Monkey	>1.0	

근거문헌 : Antimicrobial Agents and Chemotherapy (1968) : Toxicology and Pharmacology of Cephalexin in Laboratory Animals.

#### 5) 흡수 (Absorption)

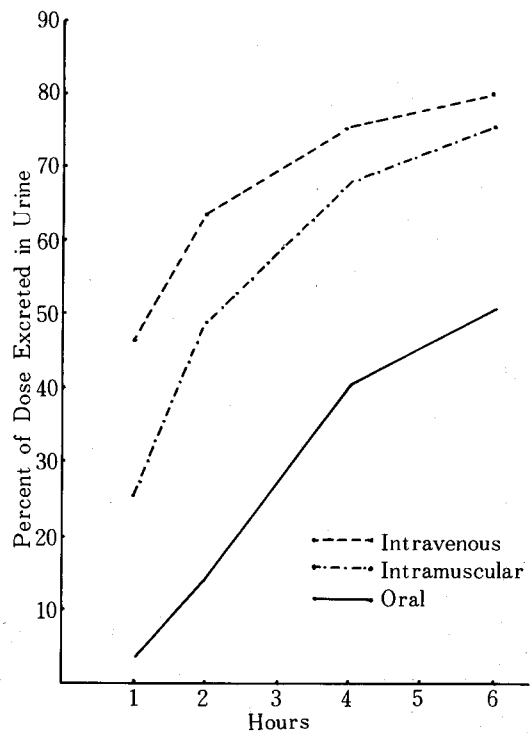


\* 체중 1 kg당 세팔렉신 10mg을 정맥내, 근육내, 경구, 직장투여 했을때의 혈청농도변화(개 6 마리 기준)

(근거문헌 : Antimicrobial Agents and Chemotherapy (1968) - Toxicology and pharmacology of laboratory Animal)

정맥내 투여했을 때 투여후 1.5~6 시간까지 혈청내에서 항균력이 일정했고 반감기는 86.2±3.9분이었다. 근육내 투여시는 15분에서 1 시간 까지 혈청 1ml당 세팔렉신 20µg의 농도가 유지됐다. 소실율은 정맥내 투여시와 비슷했다. 경구투여의 경우에는 투여후 2시간 때 16.8µg/ml의 피크를 나타냈다. 6 시간에 5.9 µg/ml의 평균농도를 유지했다. 직장 투여시는 0.5 시간에 3.6 µg/ml, 3시간에 6.3µg/ml 6시간에 3.2µg/ml를 나타냈다.

#### 6) 배출 (Excretion)



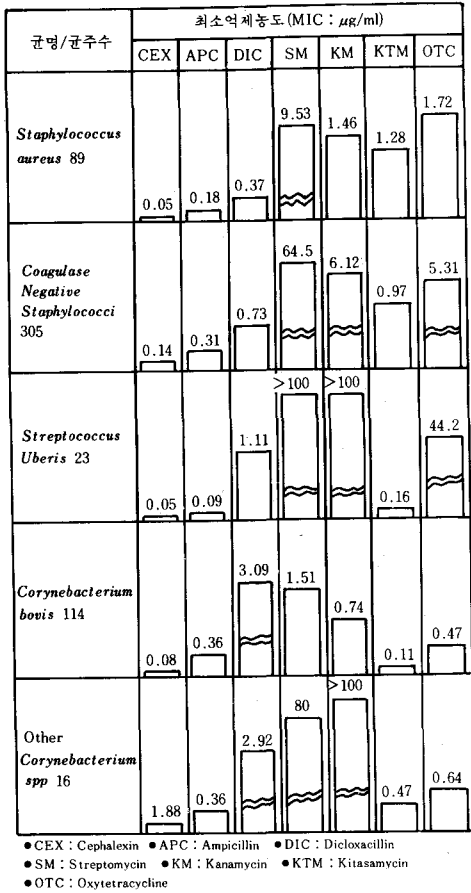
\* 체중 1 kg당 세팔렉신 10mg을 투여했을때 신장에서의 배출율(개 6마리 기준)

(근거문헌 : Antimicrobial Agents and Chemotherapy (1968) - Toxicology and Pharmacology of Cephalexin in Laboratory Animals)

정맥내, 근육내, 경구투여했을 때 6 시간내에 각각 배출율, 80, 77, 52%를 나타냈다.

#### 7) 항균력 (Antibiotic Activity)

(북해도가축임상감염소)



### 3. 세파렉신 - DC

#### 1) 성분 · 함량

세팔렉신 (Cephalexin) ..... 250mg (역가)

황산네오마이신 (Neomycin Sulfate) ..... 250mg (역가)

지속성 기제 ..... 적량

#### 2) 임상 효능

① 시험 기간 : 1983년 9월 ~ 1984년 9월 ② 대상 : 홀스타인종 46마리 (41 : 공시군 5 : 대조군)  
 ③ 방법 : 공시군 41마리중 세균수 250개/ml 이상의 60분방에 세파렉신-DC를 주입 (1분방당 1실린지) ④ 세균학적 효과 90%, 총효과 판정 76.6%로 제제 효능의 뛰어난이 입증됨.

(북해도가축임상감염소)

분리군	분방수	세균학적효과			총효과판정				
		소	불	소실(%)	탁	유	무	유(%)	
		실	대	율	월	효	효	율	
<i>Staphylococcus aureus</i>	8	6	2	100	2	4	2	75.0	
<i>Streptococcus uberis</i>	4	2	2	100	2	1	1	75.0	
<i>Streptococcus</i> spp.	1	1		100	1			100	
<i>Corynebacterium bovis</i>	17	13	3	94.1	8	6	3	82.3	
GPR	2	1	1	100		1	1	50.0	
Yeast	2	1	1	50		2		100	
Unclassified	1	1		100	1			100	
소 계	35	25	8	94.2	14	14	7	80	
<i>Staphylococcus aureus</i> & <i>staphyl.uberis</i>	2	1	1	100	1		1	50.0	
CNS	2	1		50.0		2		100	
CNS & Staphyl. Uberis	3	2	1	100	1	2		100	
<i>Corynebacterium bovis</i>	1		1	100			1	100	
<i>Micrococcus</i> spp.	2	1	1	100		1	1	50.0	
GPR	3	1	1	66.6		2	1	66.6	
<i>Streptococcus uberis</i> & <i>Corynebacterium bovis</i>	5	4		80.0	2	2	1	80.0	
Yeast	3	2		66.6		2	1	66.6	
GPR & Unclassified	4	3	1	100	2		2	50	
소 계	25	15	6	84	6	12	7	72	
합 계	60	40	14	6	90	20	26	14	76.6

### 4. 결 과

이상과 같이 세파렉신-DC에 대해서 알아 보았고 끝으로 다음과 같이 결론지어 보면 1)  $\beta$ -Lactamase에 안정되어 내성 발현의 염려가 없는 새로운 세팔로스포린계의 세팔렉신과 황산 네오마이신의 광범위 살균성 복합 항생제이고 2) 주입후 유효 혈중 농도를 오랫동안 유지하므로 건유기 유방염 치료에 적합하며 3) 유방염 발병 원인균인 포도상구균(페니실린 감수성균과 내성균) 연쇄상구균 코리네 박테리움 웨도모나스대장균 등에 강력한 효능을 발휘하도록 만들어진 유방염 연고제이다.