

第三十八章

人工合成抗菌药

01

第一节 喹诺酮类抗菌药

02

第二节 磺胺类抗菌药

03

第三节 其他合成抗菌药

人工合成抗 菌药



第三十八章 人工合成抗菌药

重点难点

重点

1. 喹诺酮类药物代表药物名称、临床应用、不良反应及用药监护。
2. 磺胺类抗菌药的分类、代表药物名称、不良反应及用药监护。

难点

1. 喹诺酮类抗菌药的作用机制。
2. 磺胺类抗菌药与甲氧苄啶组成复方制剂的意义。

第一节 喹诺酮类抗菌药

◆ 分代	代表药
□ 第一代	萘啶酸（淘汰）
□ 第二代	吡哌酸
□ 第三代	氟喹诺酮类（常用）
□ 第四代	新型氟喹诺酮类

氟喹诺酮类

- ◆ 氧氟沙星
- ◆ 左氧氟沙星
- ◆ 诺氟沙星
- ◆ 环丙沙星
- ◆ 洛美沙星
- ◆ 氟罗沙星
- ◆ 司氟沙星
- ◆ 培氟沙星
- ◆ 依诺沙星



第一节 喹诺酮类抗菌药

一、体内过程

1.吸收：口服吸收良好，但可螯合多价阳离子

如 Fe^{2+} 、 Ca^{2+} 、 Mg^{2+} 、 Zn^{2+} 等使生物利用度 ↓。

2.分布：血浆蛋白结合率低，穿透性好，分布广泛。

肺、肾、尿、胆汁、前列腺组织中浓度高。

3.代谢与排泄：少数药物可在肝代谢，经胆汁、肠道排泄。

大多数药物主要以原形经肾排泄，尿中浓度较高。

第一节 喹诺酮类抗菌药

二、抗菌作用

广谱杀菌药。

1. **G⁻菌 -- 强大**（如大肠杆菌、沙门菌、志贺菌属、弧菌、弯曲杆菌、铜绿假单胞菌等）。
2. 大多数G⁺菌 -- 作用良好 (如产酶金葡、链球菌、肠球菌)。
3. 分枝杆菌、军团菌、支原体、衣原体。
4. 厌氧菌--第4代最强。

抗菌作用机制：**主要**抑制细菌**DNA回旋酶**、干扰细菌DNA复制，杀灭细菌。

由于抗菌机制的特殊性，与其他抗生素无交叉耐药性。

第一节 喹诺酮类抗菌药

三、临床应用

1. 治疗敏感菌引起的泌尿生殖系统感染、呼吸道感染、肠道感染、淋病、骨和关节感染、皮肤和软组织感染等。

2. 替代氯霉素治疗伤寒
(首选药)。

3. 替代青霉素和头孢菌素
治疗全身感染。

4. 用于沙眼衣原体、支原体
所致的传播性疾病的
治疗。

第一节 喹诺酮类抗菌药

四、不良反应

- 01 胃肠道反应**

一般不严重，多数患者可以耐受，服用药物时应**多饮水**。
- 02 骨、关节损伤**

影响软骨发育，部分患者可出现关节痛、肌痛，可致**肌腱损伤**。
孕妇、哺乳妇女及18岁以下青少年不宜使用。
- 03 中枢神经系统反应**

表现为中枢兴奋、烦躁、失眠、头痛、眩晕，甚至抽搐、惊厥、精神错乱等。
如发生惊厥，立即停药；用药后不要从事危险性操作；精神病、癫痫患者禁用。
- 04 变态或光敏反应**

可出现药疹、皮肤瘙痒和血管神经性水肿等。可诱发**光敏性皮炎**。
用药前应先询问过敏史，用药时注意皮疹或其他过敏症状。用药期间应避免日照。
- 05 其他**

心脏毒性、肝肾功异常、眼毒性等。



第一节 喹诺酮类抗菌药

四、不良反应

**沙星会把跟腱伤，不满十八不要尝。
血糖乱了心中毒，精神失常怕见光！**

第一节 喹诺酮类抗菌药

诺氟沙星
(氟哌酸)

- 抗菌谱广，抗菌作用强。
- 对革兰阳性菌和阴性菌包括铜绿假单胞菌均有良好抗菌活性。
- 主要用于敏感菌所致泌尿道、肠道感染和淋病。

环丙沙星

- 穿透性能好，分布于全身各组织。
- 抗菌谱同诺氟沙星，抗菌活性强，对厌氧菌多数无效。
- 主要用于全身感染，也可作为骨、关节感染的有效药物。

第一节 喹诺酮类抗菌药

氧氟沙星

- 口服吸收迅速完全，生物利用度高。分布广泛，在前列腺、肺、耳鼻喉、骨组织、痰液、胆汁中均能达到有效浓度。主要经肾排泄，**尿液中浓度高**。
- 用于**敏感菌引起的呼吸道、泌尿生殖道、胆道、耳鼻喉及皮肤软组织感染**。治疗**伤寒、副伤寒**。联合其他抗结核药用于耐药结核分枝杆菌的治疗。

左氧氟沙星

- 口服生物利用度高，抗菌活性强于氧氟沙星。
- 对革兰阳性菌、阴性菌、厌氧菌具有强大杀菌作用。
- 治疗各种急慢性感染、难治性感染等。
- 不良反应低，主要是皮疹、瘙痒、红斑及胃肠反应。

第一节 喹诺酮类抗菌药

洛美沙星

- 口服吸收好，生物利用度高，体内分布广。
- 抗菌谱广，用于泌尿生殖器和皮肤软组织感染、化脓性细菌感染，也可用于抗耐药结核分枝杆菌感染、细菌性角膜炎、角膜溃疡等治疗。
- 最严重的不良反应为皮肤变态反应和光敏感反应，用药过程中应避免日照。

氟罗沙星

- 口服生物利用度高，抗菌谱广，抗菌活性强，作用时间长。
- 主要用于治疗敏感菌所致的呼吸道、泌尿生殖道、妇科、外科的感染性疾病。不良反应少且较轻。对肾功能损伤者要减量。

司帕沙星

- 口服吸收良好，肝肠循环明显。
- 因易产生光敏反应，心脏毒性和中枢神经毒性，临床应严格控制使用。

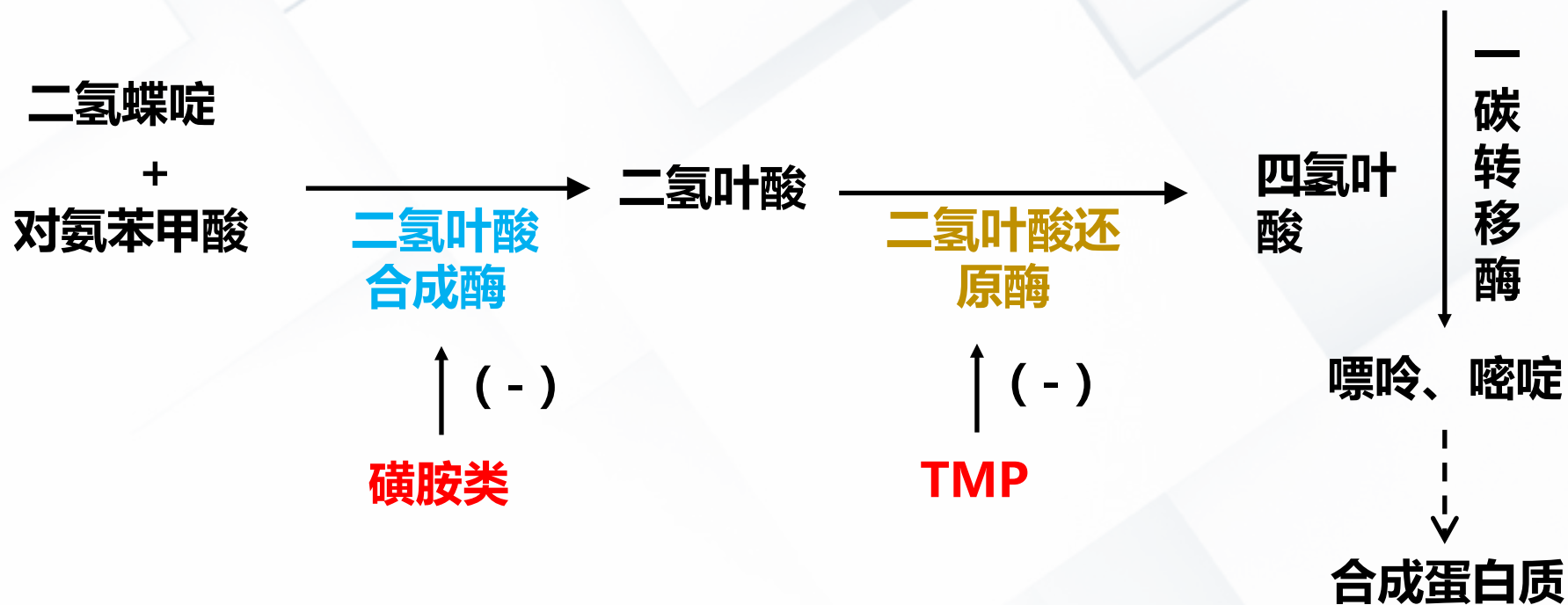
第二节 磺胺类抗菌药

一、分类及代表药（最早用于全身感染的抗菌药）

分 类		代 表 药
治疗全身感染的磺胺类药	短效类	SIZ（磺胺异恶唑）
	中效类	SD（磺胺嘧啶）
		SMZ（磺胺甲恶唑）
	长效类	SMD（磺胺甲氧嘧啶） SDM（磺胺二甲氧嘧啶）
治疗肠道感染的磺胺类药		SASP（柳氮磺吡啶）
局部外用的磺胺类药		SD-Ag（磺胺嘧啶银）
		SML（磺胺米隆）
		SA（磺胺醋酰）

第二节 磺胺类抗菌药

二、抗菌机制



磺胺类是通过抑制二氢叶酸合成酶而抑制细菌生长繁殖。

与TMP合用，双重阻断叶酸代谢。

第二节 磺胺类抗菌药

三、不良反应

01

肾损害

应注意：用药期间应大量饮水；加服碳酸氢钠碱化尿液；定期检查尿液，发现结晶尿应及时停药。老年人、肾功能不全者、脱水、少尿和休克患者慎用或禁用。

02

抑制骨髓

可引起白细胞减少，再生障碍性贫血及血小板减少症。
用药期间应定期查血常规，发现异常及时停药。

03

变态反应

较多见，有皮疹、药热等，严重者可出现剥脱性皮炎、多形性红斑。
用药前应询问患者有无过敏史，用药中应观察变态反应。

04

肝脏损害

可致黄疸、肝功能减退，严重者可发生急性肝坏死。肝功能损害者禁用。

05

其他

恶心、呕吐、眩晕、头痛、精神不振、全身乏力等。
妊娠期、哺乳期妇女禁用，新生儿及2月龄以下婴儿禁用。



第二节 磺胺类抗菌药

三、不良反应

磺胺最爱跟甲氧，双剑合璧作用大。

过敏反应最常见，伤肾喝水碱来帮。

抑制骨髓肝中毒，光敏反应别忘啦。

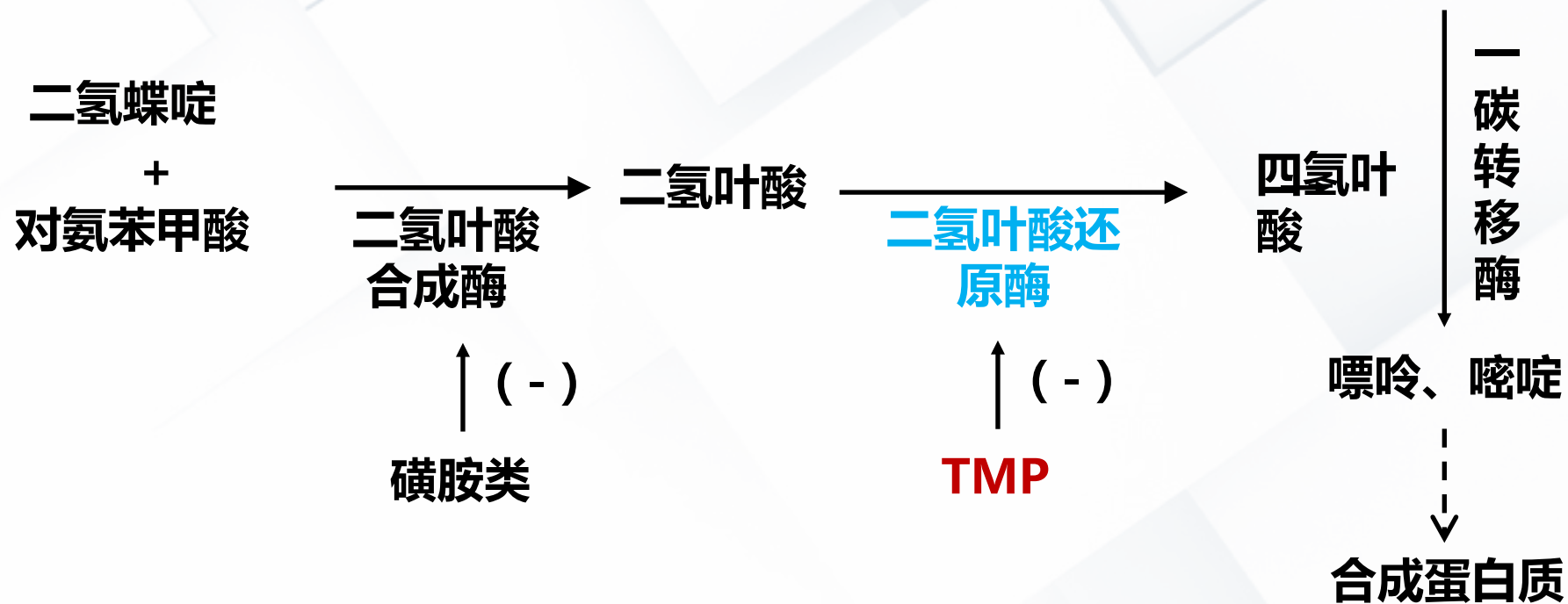
第二节 磺胺类抗菌药

四、常用药物的应用

分 类	代 表 药	主 要 应 用
治疗全身感染的磺胺类药物	SD（磺胺嘧啶）	流行性脑脊髓膜炎（首选）。
	SMZ（磺胺甲恶唑）	SMZ 常与 TMP 按 5：1 组成复方（复方新诺明）。 治疗呼吸道感染、尿路感染、肠道感染、脑膜炎、败血症及伤寒等。
治疗肠道感染的磺胺类药物	SASP（柳氮磺吡啶）	用于控制肠炎（溃疡性结肠炎）和细菌性肠炎。
局部外用的磺胺类药物	SD-Ag（磺胺嘧啶银）	烧伤引起的铜绿假单胞菌感染。
	SML（磺胺米隆）	铜绿假单胞菌等创伤感染。
	SA（磺胺醋酰）	治疗结膜炎、角膜炎、沙眼等。

第三节 其他合成抗菌药

甲氧苄啶(TMP)



TMP通过抑制二氢叶酸还原酶而抑制细菌生长繁殖。
与磺胺类药物合用，双重阻断叶酸代谢。

第三节 其他合成抗菌药

呋喃妥因

- 尿药浓度高，用于敏感菌所致的泌尿道感染。
- 不良反应有消化道反应、周围神经炎、偶见变态反应。

呋喃唑酮

- 口服吸收少，肠内浓度高，主要用于肠炎和菌痢。
- 有抗幽门螺杆菌作用，还可用于治疗消化性溃疡。

甲硝唑

- 用于厌氧菌引起的败血症、盆腔炎、骨髓炎、中耳炎、口腔感染等。
- 肠内、肠外阿米巴病的（首选）。
- 治疗阴道滴虫病（首选）。