

药化：合成抗菌药 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/16/2021_2022__E8_8D_AF_E5_8C_96_EF_BC_9A_E5_c23_16997.htm 第十二章 合成抗菌药

第一节 喹诺酮类抗菌药分类：1、萘啶羧酸类(萘啶酸) 2、喹啉羧酸类(第一代)、3、吡啶并嘧啶羧酸类(吡哌酸，第二代) 4、喹啉羧酸类(第三代)喹诺酮构效关系：1、A环是抗菌活性必须2、3位COOH、4位C=O为活性必须3、1位取代可以是

烷基或环丙基，接近乙基体积为好。4、6、8分别或同时引入氟原子，活性增加，7位以哌嗪基为好。吡哌酸：8-乙基-5-氧代-5,8-二氢-2-(1-哌嗪基)吡啶并[2,3,d]嘧啶-6-羧酸三水合物。

诺氟沙星：1-乙基-6-氟-4-氧代-1,4-二氢-7-(1-哌嗪基)-3-喹啉羧酸(氟哌酸)主用于尿道、胃肠道及盆腔的感染，皮肤软组织感染。不易耐药，使用安全。盐酸环丙沙星：1-环丙基.....稳定性好，室温5年未见异常。对绿脓、大肠杆菌、淋、链等有效。氧氟沙星：()-9-氟.....黄或灰黄结晶粉末。

主用革兰阴性菌所致感染。左氧氟沙星抗菌大2倍。结构中3,4位羧基和酮基极易与金属离子络合，降低药物活性，也使体内金属离子流失，不宜与牛奶等含钙、铁等食物和药品同服，老人与儿童不宜多服。酸碱两性，HCl或NaOH中易溶。

第二节 磺胺类药物及抗菌增效剂磺胺类构效关系：1、对氨基苯磺酰基是必须基团，邻位、间位无抑菌作用。2、芳胺基无取代，如有，必须能还原为游离基，否则无效。3、磺酰胺基上N单取代作用增强，以杂环取代增强，N、N双取代活性丧失。4、苯环被其他取代或苯环上引入其他基团，活性降低或丧失。

作用机制：与细菌生长所必须的对氨基苯甲酸(PABA)

产生竞争性拮抗，干扰细菌正常生长，抑菌。磺胺甲唑(新诺明、SMZ)：N-(5-甲基-3-异唑基)-4-氨基苯磺酰胺 抑制二氢叶酸合成酶 两性甲氧苄啶(TMP)：增效剂 5-[(3,4,5-三甲氧苯基)甲基]-2,4-嘧啶二胺 对革兰阳性和阴性菌有广泛抑制作用，可逆性抑制二氢叶酸还原酶。克拉维酸：-内酰胺酶抑制剂，与抗生素合用增强疗效。丙磺舒：降低青霉素排泄增强作用。

第三节 抗结核病药一、抗生素类抗结核病药

硫酸链霉素：一分子链霉胍与一分子链霉双糖缩合成的碱性甙，三个碱性中心。第一个抗结核病药利福平：4-甲基...肺结核及其他结核，麻风病、厌氧菌。半合成抗生素，大环内酰胺类，27个C利福喷汀：4-环戊基...同利福平，抗菌活性是利的2-10倍，常与其他结核药合用。利福霉素共性：1、遇光变质、氧化、水解 2、盐酸下与亚硝酸钠氧化成醌类，橙色变暗红。

二、合成抗结核病药

对氨基水杨酸钠：对结核杆菌有选择性抑制作用，但无杀菌作用，易产生抗药，合用。异烟肼：酰肼基，酸或碱下水解成异烟酸和肼，游离肼有毒性。遇光变质，易溶于水，性质：1、还原反应：氨制硝酸银，管壁生成银镜。2、缩合反应：肼基与香草醛、芳醛缩合成淡黄色异烟腓。3、沉淀反应：吡定啉环碱性，与铜离子(重金属盐)酸性下生成红色螯合物。4、酸性中与溴酸钾作用，作于含量测定。

盐酸乙胺丁醇：2R, 2R...极易溶于水，与其他联合治疗肺结核，单用易产生耐药性。性质：1、加硫酸铜、氢氧化钠生成络合物，蓝色。2、与苦味酸生成沉淀

第四节 其他抗菌药

1、异喹啉类抗菌类 盐酸小檗碱(盐酸黄连素)，溶于热水，微溶于水。三种形式：季铵碱式(最稳定)、醇式、醛式 性质：1、与热氢氧化钠转变为季铵型而成红色。2、稀盐酸加氯水显

红色3、多种生物碱沉淀试剂反应 4、硫酸的乙醇液水浴上加热呈翠绿，吡啶类生物碱反应硝基咪唑类：作用于微生物酶系统，抑制乙酰辅酶A，干扰微生物糖代谢，起抑菌作用。咪唑妥因：主要用于大肠杆菌、链球菌引起的泌尿道感染，如膀胱炎、肾盂肾炎等。2、硝基咪唑类替硝唑：1-[2-(乙硫酰基)乙基]-2-甲基-5-硝基-1H-咪唑 抑制厌氧菌总结：不易与含钙药同服：诺氟沙星、异烟肼、四环素、对氨基水杨酸钠与金属离子络合酸碱两性：磺胺类(SMZ)、第三代喹诺酮类、对氨基水杨酸钠 既溶于酸又溶于碱易溶于水：只有异烟肼分子中含有容易水解结构的：利福平、利福喷汀、异烟肼、链霉素 100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com