

《药理学》辅导：头孢菌素类抗生素 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/18/2021\\_2022\\_\\_E3\\_80\\_8A\\_E8\\_8D\\_AF\\_E7\\_90\\_86\\_E5\\_c23\\_18458.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/18/2021_2022__E3_80_8A_E8_8D_AF_E7_90_86_E5_c23_18458.htm) 头孢菌素类是一类广谱

半合成抗生素，其母核为7-氨基头孢烷酸（7-ACA），由头孢菌素C裂解获得。与青霉素类抗生素化学结构相同之处是均有一个  $\beta$ -内酰胺环，不同的是另一个环不是噻唑环而为六元双氢噻嗪环。头孢菌素已发展有四代，比较每代的特点下：

：第一代头孢菌素：药物有头孢噻吩（cefalothin）、头孢唑啉（cefazolin）、头孢氨苄（cefalexin）等；该类头孢菌素对G菌包括耐药金葡菌的抗菌作用强于第二至第四代；对G-菌作用弱，对铜绿假单胞菌、厌氧菌无效；对青霉素酶较稳定，但对各种 $\beta$ -内酰胺酶稳定性远比二至四代差；组织穿透力差，脑脊液浓度低；对肾脏有一定的毒性。主要用于耐药金葡菌及敏感菌所致的轻、中度感染，如呼吸道、尿路感染及皮肤、软组织感染等。

第二代头孢菌素：药物有头孢呋辛（cefuroxime）、头孢孟多（cefamandole）、头孢克洛（cefaclor）、头孢丙烯（cefprozil）等；前二者为注射制剂，后两者为口服制剂。对G菌作用比第一代稍逊；对G-菌作用比第一代强；对铜绿假单胞菌无效，但头孢孟多对厌氧菌有效；对多种 $\beta$ -内酰胺酶比较稳定；肾脏毒性降低。主要用于敏感阳性和阴性菌，尤其是产酶耐药的阴性菌所致的呼吸道感染、胆道感染、骨关节感染及皮肤软组织感染、泌尿道感染、妇产科感染及耐青霉素淋球菌感染等。

第三代头孢菌素：药物有头孢噻肟（cefotaxime）、头孢曲松（ceftriaxone）、头孢他定（ceftazidime）、头孢哌酮

（ceftriaxone）、头孢他定（ceftazidime）、头孢哌酮

(cefoperazone) 等?对G菌抗菌作用不及1~2代;?对G-菌抗菌作用明显超过1~2代,包括肠杆菌科、铜绿假单胞菌及厌氧菌均有较强作用;?对多种 $\beta$ -内酰胺酶特别是对G-杆菌产生的广谱 $\beta$ -内酰胺酶高度稳定;?体内分布广,组织穿透力强,有一定量渗入脑脊液;?对肾脏基本无毒性;?主要用于重症耐药G-杆菌感染。第四代头孢菌素:头孢匹罗(cefpirome)、头孢吡肟(cefepime)、头孢利定(cefolidin)、头孢噻利(cefoselis)?具有第三代头孢菌素对革兰阴性菌较强的抗菌作用;?对G菌的作用比第三代增强;?对 $\beta$ -内酰胺酶尤其是超广谱质粒、染色体介导的酶稳定;?有些药物如头孢地嗪还能增强机体防御功能,刺激吞噬细胞杀菌作用;?无肾脏毒性;?主要用于重症耐药G-杆菌感染,特别是威胁生命的严重革兰阴性杆菌感染及免疫功能低下的重症;为提高疗效,铜绿假单胞菌感染可合用抗铜绿假单胞菌的广谱青霉素或氨基苷类抗生素;厌氧菌混合感染可合用甲硝唑。

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](http://www.100test.com)