

执业药师考前辅导药物化学[3] PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/183/2021_2022__E6_89_A7_E4_B8_9A_E8_8D_AF_E5_c23_183207.htm 第十三章 抗生素作用机制有四种：1、干扰细菌细胞壁的合成 青霉素类、头孢类 D-丙胺酸多肽转移酶抑制剂 2、影响细菌蛋白质的合成 四环素、氨基糖苷类、大环内酯类、氯霉素类 3、抑制细菌核酸的合成 利福平 4、损伤细胞膜 多肽类、多烯类 第1节 --内酰胺类抗生素 一、青霉素及半合成青霉素类 6-APA (2S, 5R, 6R) 过敏原：青霉噻唑基，故有交叉耐药性 青霉素G：1、酸性下不稳定，分子重排成青霉二酸 3、碱中羟肟酸铁反应 碱开环 2、强酸加热下成青霉醛和青霉胺 4、酰胺侧链影响活性，口服水解破坏 氨苄西林：成钠盐供注射，第一个用于临床的广谱青霉素。用右旋体。市售三水物 性质：1、 α -氨基酸：茚三酮反应 2、多肽链：双缩脲反应，碱性酒石酸酮紫色。阿莫西林：(羟氨苄青霉素) 右旋体。同上，发生青霉素的降解反应和氨苄西林的聚合反应。替莫西林：-CHO，对-内酰胺酶高度稳定。革兰氏阴性菌引起的尿路和软组织感染。-噻吩 哌拉西林：常用钠盐。在 α -氨基上引入极性较大基团，对绿脓杆菌有效。广谱、长效 二、头孢菌素及半合成头孢菌素类：7-ACA (6R, 7R) 对酸较稳定，与青霉素很少或无交叉过敏性，彼此无交叉过敏反应。头孢噻吩钠：第一代头孢菌素。用于耐青霉素细菌引起的各种感染，口服不易吸收，注射给药。头孢噻肟钠：第三代头孢菌素。对革兰氏阴性菌，尤肠杆菌强。甲氧肟基对-内酰胺酶高度稳定，顺式大于反式100倍，光照下易顺转反，故避光。二氨基噻唑基团，增

加亲和力，广谱。只能注射、耐酶、广谱。头孢哌酮钠：第三代头孢菌素。对绿脓杆菌的作用较强，注射给药。与哌拉西林相似 头孢氨苄：臭。阳性大于阴。干燥下稳定，强酸强碱、热、紫外线水解。PH 8.5以下稳定。性质：1、茚三酮反应 2、硝酸-硫酸：黄色(头孢类反应) 头孢羟氨苄：特异臭。性质同上，可口服。 头孢克洛：为半合成可口服的第二代头孢菌素。 三、非经典的 β -内酰胺类抗生素及 β -内酰胺酶抑制剂 克拉维酸、舒巴坦、氨曲南：对酶有抑制，本身又具有抗菌活性。

第二节 四环素类抗生素 由放线菌产生的一类广谱抗生素，菲烷骨架。 一、天然四环素：金霉素，土霉素，四环素。 二、半合成四环素类抗生素 第三节 氨基糖苷类抗生素 链霉素、卡那霉素、庆大霉素、新霉素。碱性，硫酸盐，良好水溶性。性质稳定，可配制成水液保存，具旋光性。副作用损害第八对颅脑神经，引起不可逆耳聋，对儿童毒性大。 阿米卡星：半合成氨基糖苷类抗生素。适于对卡那、庆大霉素耐药的G所致的尿路、败血症等。性质：1、与蒽酮的硫酸溶液显蓝色 2、碱性下与硝酸钴沉淀 3、茚三酮反应 第四节 大环内酯类抗生素 红霉素：十四元大环，酸性不稳定。首选耐药的金黄色葡萄球菌和溶血性链球菌引起的感染。水溶性小，只能口服，酸中不稳定，易被胃酸破坏。与乳糖酸成盐供注射用。另有罗红霉素、麦迪霉素、螺旋霉素。 第五节 氯霉素类抗生素 氯霉素：两个手性C，四个异构体，1R，2R[D-(-)苏阿糖型]有活性。无水乙醇右旋，乙酸乙酯左旋。性质：1、白或黄绿色晶状结晶 2、性质特稳定，耐热，强酸强碱水解--苯腙 3、--NO，与氯化钙和锌粉还原...铁成络合物 应用：治疗伤寒、副伤寒等。长期损害骨骼的造血功能

，引起再生障碍性贫血。甲砒霉素：合成的氯霉素类似物。将硝基换成强吸电子基甲砒基(HCO S-)，混旋与左旋基本一致。第六节 其他抗生素 盐酸林可霉素、林霉素。总结：右旋体：氨苄西林、阿莫西林，氨基糖苷类具旋光性 水合茚三酮反应：(α-氨基酸) 头孢氨苄、头孢羟氨苄、氨苄西林、阿莫西林、阿米卡星、链霉素、庆大霉素 稳定：氯霉素(强酸强碱水解)、氨基糖苷类(可成水液)、头孢氨苄(PH 8.5以下稳定)。-内酰胺酶高度稳定：替莫西林：-CHO 头孢噻肟钠：甲氧肟基；二氨基噻唑，广谱 酸中不稳定：红霉素、青霉素G 生物合成：青霉素、红霉素 除钠盐几乎都不溶于水

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