

2007年执业药师考试考点汇总与解析-药理学-人工合成抗菌药物 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/249/2021_2022_2007_E5_B9_B4_E6_89_A7_c23_249825.htm

考点1：喹诺酮类抗菌药物

喹诺酮类抗菌药物是一类人工合成的抗菌药，具有抗菌谱广、抗菌力强、口服吸收好，组织浓度高、与其他抗菌药物无交叉耐药性、不良反应少等特点，已成为临床治疗细菌感染性疾病的常用药物。喹诺酮类药物的作用机制为抑制DNA回旋酶的A亚单位的切割及封口活性，阻碍细菌DNA合成而导致细菌死亡。喹诺酮类药物分为四代：第一代包括萘啶酸和吡哌酸，已属淘汰药物。第二代为诺氟沙星、氧氟沙星、环丙沙星。第三代为司帕沙星、左氧氟沙星、格帕沙星等新氟喹诺酮类。第四代为克林沙星、加替沙星等的最新喹诺酮类。临床常用的氟喹诺酮类品种有：诺氟沙星（氟哌酸）、依诺沙星（氟啶酸）、培氟沙星（甲氟哌酸）、环丙沙星（环丙氟哌酸）、氧氟沙星（氟嗪酸）、左氧氟沙星、洛美沙星、托氟沙星（多氟啶酸）、氟罗沙星（多氟哌酸）、芦氟沙星、司氟沙星、格帕沙星、曲伐沙星等。【药动学】氟喹诺酮类大多口服吸收良好，给药后1~2h内达到血药峰浓度，除诺氟沙星和环丙沙星外。生物利用度高，喹诺酮类可螯合二价和三价阳离子，不能与含有Ca²⁺、Mg²⁺、Zn²⁺的食品、药物同服。t_{1/2}较长，多为3.5~7.0h，与血浆蛋白结合率低，一般为10%~37%，表观分布容积大，体内的分布较广，可进入骨、关节、前列腺等，培氟沙星、氧氟沙星、环丙沙星可进入脑脊液，能达到有效治疗浓度。在某些组织内，浓度可接近甚至超过同期的血药浓度。本类少数药物通

过肝脏代谢，大多数主要以原形由肾脏排泄，但各药差异较大，氧氟沙星、左氧氟沙星、洛美沙星、氟罗沙星主要自肾排出，而环丙沙星、依诺沙星、诺氟沙星则部分在肝脏生物转化，部分自肾排出。【抗菌作用】氟喹诺酮类为杀菌剂，具有较长的PAE，即使血药浓度已降低到检测限下，仍在2~6h内对某些细菌具有明显的抑制作用。第一代喹诺酮类产品抗菌谱窄，仅对大肠埃希菌、变形杆菌属、沙门菌属、志贺菌属的部分菌株有抗菌活性。第二代喹诺酮类药物对产气菌、荚膜梭菌、流感杆菌、克雷伯菌属、枸橼酸杆菌属、变形杆菌属、沙门菌属、志贺菌属等肠科细菌有强大抗菌活性。第三代喹诺酮类药物对革兰阴性菌的抗菌作用增强，如大肠杆菌、痢疾杆菌、伤寒杆菌、产气杆菌、变形杆菌、流感杆菌、淋球菌等，抗菌谱扩大到金葡菌、肺炎链球菌、溶血性链球菌、肠球菌等革兰阳性球菌、衣原体、支原体、军团菌及结核杆菌。托氟沙星、司氟沙星抗革兰阳性菌作用强；托氟沙星、司氟沙星对厌氧菌作用强，司氟沙星还对支原体、衣原体、分枝杆菌等作用强；洛美沙星体内抗菌活性优于诺氟沙星、格帕沙星，抗肺炎球菌作用强。第四代喹诺酮类药物的抗菌谱进一步扩大，对部分厌氧菌、革兰阳性菌的耐菌及铜绿假单胞菌的抗菌活性也明显提高。【临床应用】1.泌尿生殖道系统感染。广泛用于单纯性或复杂性尿路感染。急慢性细菌性前列腺炎、淋球菌性尿道炎、宫颈炎宜选用经尿排泄较多的氧氟沙星、洛美沙星、依诺沙星等。2.肠道感染。本类药物对消化道溃疡相关的螺旋杆菌、大肠杆菌、弯曲杆菌、变形杆菌、志贺菌、伤寒沙门菌等敏感，用于常见的细菌性肠炎、菌痢、伤寒、副伤寒等。3.呼吸道感染。对

下呼吸道感染效果好。常用于肺炎链球菌、流感嗜血杆菌或其他莫拉菌引起的支气管炎和鼻窦炎；也可用于克雷伯菌属、大肠埃希菌和铜绿假单胞菌等革兰阴性杆菌和金葡菌所致的肺炎和支气管感染。本类药物可替代大环内酯类抗生素，用于嗜肺军团菌和其他军团菌所致的感染和分枝杆菌感染。左氧氟沙星可有效治疗肺炎链球菌、肺炎支原体、肺炎衣原体引起的肺炎。

4.骨骼系统感染。对急慢性骨髓炎、化脓性关节炎治疗，本类药物为首选，药物渗入骨组织超过其他药物。

5.皮肤软组织的感染。本类药物用于包括革兰阴性杆菌所致的五官科感染和伤口感染。

6.其他。本类药物也用于治疗败血症、细菌性脑膜炎、腹膜炎等严重感染。可替代氯霉素用于伤寒治疗。

【不良反应】喹诺酮类药物不良反应轻，尤以氟喹诺酮类药物的不良反应低。主要不良反应为消化道反应，有恶心、呕吐、上腹不适、腹痛腹泻、食欲减退等，以诺氟沙星和环丙沙星为多。长期服药可导致难辨梭状芽孢杆菌性腹泻。中枢神经系统不良反应有：头晕、头痛、情绪不安、烦躁、失眠、眩晕等，仅次于消化道反应。不宜用于有中枢神经系统病史者，尤其是有癫痫病史的患者。可发生皮疹、血管神经性水肿、光敏性皮炎等变态反应；可发生一过性白细胞减少；有时可引起关节痛、肌肉痛和关节炎。与制酸药物同时服用，形成络合物，减少其肠道吸收。对幼年动物可引起轻度软骨组织损害，不宜用于妊娠期妇女和骨质未发育完全的小儿。药物分泌于乳汁，哺乳妇服用时应停止哺乳；肾功能减退者，应用经肾排出的药物如氧氟沙星应减量。

考点2：诺氟沙星（氟哌酸）【药动学】本品口服吸收迅速，约2h血药浓度达峰值，蛋白结合率低（10%~15%）

，在肾脏和前列腺中的药物浓度为血中的6.6倍和7.7倍，在胆汁中的浓度亦高， $t_{1/2}$ 平均2.5h，口服剂量的1/3经尿排出，其中80%为原形药物。【药理作用】本品是第一个氟喹诺酮类药物，在本类药物中抗菌活性最低。【临床应用】主要用于革兰阳性球菌和革兰阴性菌引起的无并发症的感染，如泌尿道和胃肠道感染及软组织、眼睛的感染。【不良反应】少见，有胃肠道刺激。【禁忌证】对本品过敏的患者禁用，孕妇、哺乳期妇女和青春期前儿童禁用。

考点3：环丙沙星（环丙氟哌酸，希普辛，CPEX，悉复欢）本品是目前氟喹诺酮类中应用最广泛的品种。【药动学】本品口服生物利用度为38%~60%，血药浓度低，静脉滴注为佳。 $t_{1/2}$ 为3.3~5.8h，药物吸收后体内分布广泛。【药理作用】本品抗菌谱广，体外抗菌活性为目前临床应用喹诺酮类中最强的。对耐药绿脓杆菌、甲氧西林耐药金葡菌、产青霉素酶淋球菌、产酶流感杆菌等均有良效。对肺炎军团菌及弯曲杆菌也有高效。对氨基糖苷类、第三代头孢菌素耐药的革兰阳性和革兰阴性菌依然敏感。【临床应用】用于全身感染，包括呼吸道、泌尿道、消化道、皮肤软组织感染均有效，对前列腺炎也有效。因本品能部分渗入脑组织和脑脊液，可用于治疗流行性脑脊髓膜炎和化脓性胸膜炎，但厌氧菌无效。【不良反应】严重抑制茶碱的正常代谢，联合应用可引起茶碱的严重不良反应，应监测茶碱的血药浓度。对咖啡因，可能对华法林也有同样影响，应予注意。【禁忌证】孕妇、授乳妇女和未成年者禁用。

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