

第四十二章 第二节 磺胺类药药师资格考试 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/582/2021_2022__E7_AC_AC_E5_9B_9B_E5_8D_81_E4_c23_582950.htm

磺胺类药是三十年代发现的能有效防治全身性细菌性感染的第一类化疗药物。在临床上现已大部被抗生素及喹诺酮类药物取代，但由于磺胺药有对某些感染性疾病（如流脑、鼠疫）、具有疗效良好，使用方便、性质稳定、价格低廉等优点，故在抗感染的药物中仍占一定地位。磺胺类药与磺胺增效剂甲氧苄啶合用，使疗效明显增强，抗菌范围增大。「结构和分类」磺胺类药是人工合成的氨基磺胺衍生物。氨基磺胺分子中的磺酰胺基上一个氢原子（R1）被杂环取代可得到口服易吸收的，用于全身性感染的磺胺药如磺胺嘧啶，磺胺异唑，磺胺甲唑等。如将氨基磺胺分子中的对位氨基上一个氢原子（R2）取代则可得到口服难吸收的，用于肠道感染的磺胺药如柳氮磺胺吡啶等等。此外，还有外用磺胺药如磺胺嘧啶银等。「药理学特点」 抗菌谱广，对金葡菌、溶血性链球菌、脑膜炎球菌，志贺菌属，大肠杆菌、伤寒杆菌，产气杆菌及变形杆菌等有良好抗菌活性，此外对少数真菌，衣原体、原虫（疟原虫和弓形体也有效）； 细菌对各种磺胺药间有交叉耐药性；磺胺药中有可供局部应用，肠道不易吸收及口服易吸收者，后者吸收完全血药浓度高，组织分布广； 磺胺嘧啶（SD）、磺胺甲唑（SMZ）脑膜通透性好，脑脊液内药物浓度高； 主要经肝代谢灭活，形成乙酰化物后溶解度低，易引起血尿，结晶尿及肾脏损害； 不良反应较多，常见有恶心、呕吐、皮疹、发热、溶血性贫血，粒细胞减少，肝脏损害、肾

损害等。「作用机制」磺胺药是抑菌药，它通过干扰细菌的叶酸代谢而抑制细菌的生长繁殖。与人和哺乳动物细胞不同，对磺胺药敏感的细菌不能直接利用周围环境中的叶酸，只能利用对氨基苯甲酸（PABA）和二氢蝶啶，在细菌体内经二氢叶酸合成酶的催化合成二氢叶酸，再经二氢叶酸还原酶的作用形成四氢叶酸。四氢叶酸的活化型是一碳单位的传递体，在嘌呤和嘧啶核苷酸形成过程中起着重要的传递作用。磺胺药的结构和PABA相似，因而可与PABA竞争二氢叶酸合成酶，障碍二氢叶酸的合成，从而影响核酸的生成，抑制细菌生长繁殖。「各种磺胺药特点」1.用于全身性感染的磺胺药 口服易吸收的磺胺药，可用于治疗全身感染，根据血浆 $t_{1/2}$ 长短将药物分为三类：短效类（ < 10 小时）、中效类（ $10 \sim 24$ 小时）和长效类（ > 24 小时）。短效和中效磺胺药抗菌力强，血中或其他体液中浓度高，临床最为常用；长效磺胺药抗菌力弱，血药浓度低，且过敏反应多见，许多国家已淘汰不用。磺胺异唑（sulfafurazole，sulfisoxazole，SIZ）又名茵得清，是短效磺胺药，血浆 $t_{1/2}$ 为 $5 \sim 7$ 小时，乙酰化率较低。尿中浓度最高，可达 $1000 \sim 2000\text{mg/L}$ ，适于治疗尿路感染。在尿中不易析出结晶。每日需服药4次，消化道反应多见。磺胺嘧啶（sulfadiazine，SD）中效磺胺药，口服易吸收，给药后 $3 \sim 4$ 小时，血药浓度达峰值，血浆 $t_{1/2}$ 为 $10 \sim 13$ 小时。抗菌力强，血浆蛋白结合率最低约 25% ，易透过血脑屏障，脑脊液浓度可达血浆浓度的 $40\% \sim 80\%$ 。是治疗流行性脑脊髓膜炎的首选药物，也适用于治疗尿路感染。但在尿中易析出结晶，需注意对肾的损害。磺胺甲唑（sulfamethoxazole，sinomin，SMZ）又名新诺明，是中效磺胺药，血浆 $t_{1/2}$ 为 $10 \sim 12$ 小时

。抗菌作用与SIZ相似。蛋白结合率较高（60%~80%），脑脊液浓度不及SD，尿中浓度虽低于SIZ但与SD接近，故也适用于治疗尿路感染。在酸性尿液中可析出结晶而损害肾，需注意碱化尿液。磺胺甲氧嘧啶（sulfamethoxydiazine，SMD）是长效磺胺药，血浆 $t_{1/2}$ 为30~40小时。抗菌力较弱。在体内维持时间较长，可每日服药一次。乙酰化率低，尿中溶解度高，不易析出结晶。磺胺多辛（sulfadoxine，SDM）又名周效磺胺；是长效磺胺药，血浆 $t_{1/2}$ 为150~200小时。在体内维持时间最长，可每3~7日服药一次。抗菌力较弱，适于轻症感染及预防链球菌感染，对疟疾等也有效。

2.用于肠道感染的磺胺药 柳氮磺吡啶（sulfasalazine，salicylazosulfapyridine）口服吸收较少，对结缔组织有特殊的亲和力并从肠壁结缔组织中释放出磺胺吡啶而起抗菌、抗炎和免疫抑制作用。适于治疗非特异性结肠炎，长期服用可防止发作。由于疗程长，易发生恶心，呕吐皮疹及药热等反应。

3.外用磺胺药 磺胺嘧啶银（sulfadiazine silver）能发挥SD及硝酸银两者的抗菌作用，抗菌谱广，对绿脓杆菌抑制作用强大，尚有收敛作用，能促进创面的愈合，适用于二度或三度烧伤。

磺胺米隆（sulfamylon，SML）又名甲磺灭脓，是对位氨基磺胺药物，因此其抗菌作用不受脓液和坏死组织的影响。对绿脓杆菌、金葡菌及破伤风杆菌有效。能迅速渗入创面及焦痂中，并能促进创面上皮生长愈合及提高植皮成活率。适用于烧伤和大面积创伤后感染。

磺胺醋酰（sulfacetamide，SA）其钠盐水溶液（15%~30%）接近中性，局部应用几乎无刺激性，穿透力强。用于治疗沙眼，结膜炎和角膜炎等。

更多信息请访问：[执业医师网校](#) [百考试题论坛](#) [百考试题在线考试系统](#) [百考试](#)

题执业药师加入收藏 特别推荐：2009年药师资格考试报名时间汇总"#F8F8F8" 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