

药物化学磺胺类药物及抗菌增效剂执业药师考试 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/595/2021_2022__E8_8D_AF_E7_89_A9_E5_8C_96_E5_c23_595660.htm

磺胺类药物为对氨基苯磺酰胺的衍生物，具有以下基本结构：磺胺类药物在20世纪30年代发展很快，临床上应用的药物曾有20余种，40年代以后由于青霉素等抗生素的出现，磺胺类药物在化学治疗药物中的地位下降，但是磺胺类药物有抗菌谱广、疗效确切、可以口服，吸收较迅速等特点。与抗菌增效剂甲氧苄

啉(Trimethoprim)合用可使抗菌作用增强。仍为比较常用的抗菌药。磺胺类药物作用机制的阐明，确立了抗代谢学说，为发展新药开辟了一条新途径。目前临床上使用较多的药物有磺胺嘧啶(Sulfadiazine)和磺胺甲唑(Sulfamethoxazole)。

一、磺胺类药物作用机制 磺胺类药物作用机制有多种学说其中众所公认的Wood-Fields学说认为磺胺类药物能与细菌生长所必需的对氨基苯甲酸(PABA)产生竞争性拮抗，干扰了细菌的酶系统对PABA利用，PABA是叶酸的组成部分，叶酸为微生物生长中必要物质，也是构成体内叶酸辅酶的基本原料

。PABA在二氢蝶酸合成酶的催化下，与二氢蝶啶焦磷酸酯及谷氨酸或二氢蝶啶焦磷酸酯与对氨基苯甲酰谷氨酸合成二氢叶酸。再在二氢叶酸还原酶的作用下还原成四氢叶酸，为细菌合成核酸提供叶酸辅酶。由于磺胺类药物分子大小及电荷分布和PABA及为相似，使得在二氢叶酸的生物合成中，可以取代PABA位置，磺胺类药物抑制二氢蝶酸合成酶，阻断了二氢叶酸的生物合成。二氢叶酸经二氢叶酸还原酶作用还原为四氢叶酸，后者进一步合成辅酶F。辅酶F为DNA合成中所必

需的嘌呤、嘧啶碱基的合成提供一个碳单位。人体作为微生物的宿主，可以从食物中摄取四氢叶酸，因此，磺胺类药物不影响正常叶酸代谢，而微生物靠自身合成四氢叶酸，一旦叶酸代谢受阻，生命不能继续，因此微生物对磺胺类药物敏感。

二、磺胺嘧啶（Sulfadiazine）化学名：4-氨基-N-2-嘧啶基苯磺酰胺 性质：1.磺胺嘧啶为两性化合物，可在稀盐酸或氢氧化钠试液、氨试液中溶解。这是由于磺胺类药物分子中磺酰氨基上的氢，受磺酰基吸电子作用的影响易解离，显弱酸性。芳氨基显碱性的缘故。2.磺胺嘧啶结构中有芳伯氨基，显芳香第一胺鉴别反应（重氮化-偶合反应）3.磺胺嘧啶溶于稀氢氧化钠液中，与硫酸酮试液反应，生成黄绿色沉淀，放置后变为紫色。这是由于磺胺类药物分子中磺酰氨基上的氢原子具有酸性，与硫酸铜试液反应，生成难溶性有颜色的酮盐，各种磺胺类药物的酮盐颜色不同，可供鉴别。如与硝酸银溶液反应，可生成磺胺嘧啶银（Sulfadiazine Silver）为用于烧伤创面的磺胺药。用途：对脑膜炎双球菌、肺炎链球菌等的抑制作用较强。能透过血脑屏障，可用于预防及治疗流行性脑炎。

三、磺胺甲唑（Sulfamethoxazole）化学名：4-氨基-N-（5-甲基-3-异唑基）苯磺酰胺，又名新诺明，SMZ 性质：与磺胺嘧啶相似，但其酮盐为草绿色沉淀。用途：抗菌谱与磺胺嘧啶相近，抗菌作用较强。常与抗菌增效剂甲氧苄啶制成复方应用，临床用于尿路感染、呼吸道感染等。

四、甲氧苄啶（Trimethoprim）化学名：5-（3，4，5-三甲氧基苯基）甲基]-2，4-嘧啶二胺 用途：甲氧苄啶为广谱抗菌药。它对革兰氏阳性菌和革兰氏阴性菌具有广泛的抑制作用。其作用机制为可逆性抑制二氢叶酸还原酶，使二氢叶酸还原为四

氢叶酸的过程受阻，影响辅酶F的形成，从而影响微生物DNA、RNA及蛋白质的合成，使其生长繁殖受到抑制。与磺胺类药物制成复方合用，使细菌的叶酸代谢受到双重阻断，从而使其抗菌作用增强数倍至数十倍，同时可减少对细菌的耐药性。更多信息请访问：执业药师网校 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 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