

药物化学喹诺酮类抗菌药执业药师考试 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\\_595661.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/595/2021_2022__E8_8D_AF_E7_89_A9_E5_8C_96_E5_c23_595661.htm)

一、喹诺酮类药物的发展 第一代是以萘啶酸（Nalidixicacid）、吡咯酸

（Piromidicacid）为代表的对革兰氏阴性菌有活性的药物，但抗菌谱窄，易形成耐药性，作用时间短，中枢副作用较大，现已少用。

第二代是以吡哌酸（PipemidicAcid）和西诺沙星（Cinoxacin）为代表，虽然仅对革兰氏阴性菌药物显活性但其副作用较少，在体内较稳定，药物以原形从尿中排出。对尿路及肠道感染也有作用。

第三代喹诺酮类抗菌药为在喹诺酮的6位引入氟原子，使得此类药物具有良好的组织渗透性，药代动力学参数及吸收、分布代谢状况均佳。具有抗菌谱广

，对革兰氏阴性菌和阳性菌及支原体、衣原体、军团菌及分枝菌都有明显的抑制作用，特别是对包括绿脓杆菌在内的革兰氏阴性菌的抗菌作用比庆大霉素等氨基糖苷类抗生素还强，临床上用于治疗敏感菌所引起尿道、肠道等感染性疾病，已经成为新一代的抗菌药物，其发展速度极快。较为有代表性的药物有诺氟沙星（Norfloxacin）、环丙沙星

（Ciprofloxacin）、氧氟沙星（Ofloxacin）、左氟沙星（Levofloxacin）、依诺沙星（Enoxacin）、洛美沙星（Lomefloxacin）、培氟沙星（Pefloxacin）、氟洛沙星（Fleroxacin）、妥舒沙星（Tosufloxacin）、斯帕沙星（Sparfloxacin）、妥美沙星（Tomefloxacin）、巴罗沙星（Balofloxacin）等。现已证实喹诺酮类药物作用的靶点为DNA拓扑异构酶，又称回旋酶。

二、诺氟沙星

( Norfloxacin ) 化学名：1-乙基-6-氟-4-氧代-1, 4-二氢-7-(1-哌嗪基)-3-喹啉羧酸，又名氟哌酸。性质：1.诺氟沙星分子结构母核为喹啉环，由于3位有羧基，7位有哌嗪基因此具有酸、碱两性，可溶于盐酸或氢氧化钠溶液中。2.诺氟沙星在室温下较稳定，遇光分解颜色变深。用途：为第三代喹诺酮类药物，用于敏感菌所致的泌尿道、肠道等感染性疾病。

三、环丙沙星 ( Ciprofloxacin ) 化学名：1-环丙基-6-氟-1, 4-二氢-4-氧代-7-(1-哌嗪基)-3-喹啉羧酸，又名：环丙氟哌酸。性质：临床以其盐酸盐一水合物制成片剂供口服，以其乳酸盐供注射用。性质稳定，但加热或光照可致分解。为第三代喹诺酮类药物，抗菌谱与诺氟沙星相似。

四、氧氟沙星 ( Ofloxacin ) 化学名：( ± )-9-氟-2, 3-二氢-3-甲基-10-(4-甲基-1-哌嗪基)-7-氧代-7H-吡啶并[1, 2, 3-de][1, 4]苯并嗪-6-羧酸，又名氟嗪酸。性质：氧氟沙星为第三代喹诺酮类药物，结构中3位为手性碳原子，其左旋体称为左氟沙星 ( Levofloxacin ) 抗菌活性为氧氟沙星 ( 消旋体 ) 2倍。氧氟沙星主要用于革兰阴性菌所致的呼吸道、扁桃体、泌尿道等感染。

五、依诺沙星 ( Enoxacin ) 化学名：1-乙基-6-氟-4-氧代-1, 4-二氢-7-(1-哌嗪基)-1, 8-二氮萘-3-羧酸，又名氟啶酸。性质：依诺沙星为第三代喹诺酮类药物，具有广谱抗菌活性，抗菌谱与氧氟沙星相似。

六、喹诺酮类药物的构效关系

- 3位羧基和4位羰基是活性必须基团，如果被其他取代基取代则活性消失。
- 1位取代基对活性影响大，若为脂肪烃基取代，以乙基或乙基体积相近的取代基为好；若为脂环烃基取代，以环丙基最好；若为芳烃基取代，可以是苯基或其它芳烃基。
- 5位以氨基取代最好。
- 6, 8位分别或同时引入氟

原子，抗菌活性增大。5.7位引入五元或六元杂环，抗菌活性增大，以引入哌嗪环为最好。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](http://www.100test.com)