

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_ti2020/621/2021_2022__E8_8D_AF_E7_89_A9_E5_8C_96_E5_c23_621509.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