

药物化学抗结核药物执业药师考试 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_621511.htm

抗结核药物根据化学结构分为合成抗结核药和抗结核抗生素。一、合成抗结核药
合成抗结核药主要包括异烟肼（Isoniazid）、对氨基水杨酸钠（SodiumAminosalicylate）、乙胺丁醇（Ethambutol）。

1.异烟肼（Isoniazid）化学名：4-吡啶甲酰肼，又名雷米封（Rimifon）。

性质：（1）异烟肼为无色结晶或白色的结晶性粉末，易溶于水，遇光渐变质。（2）异烟肼结构中有肼基，与香草醛缩合生成黄色异烟腓。Mp228~231，熔融时同时分解。（3）异烟肼结构中有肼基，肼基具有还原性，与氨制硝酸银试液反应，异烟肼被氧化，生成异烟酸铵，同时有黑色的金属银生成，并在试管壁上生成银镜。（4）异烟肼在酸性溶液中与溴酸钾反应被氧化，生成异烟酸、溴化钾和氮气，此反应可用于含量测定。（5）异烟肼分子中有酰肼结构，在酸性或碱性条件下，可水解生成异烟酸和肼。光、温度、pH、重金属离子等可使水解加速。游离肼的毒性大，变质后不可再供药用。（6）异烟肼可与酮、铁、锌等离子络合，生成有色的螯合物，微量金属离子存在，可使异烟肼溶液变色，因此配置时需避免与金属器皿接触。用途：异烟肼对结核菌有良好的抗菌作用，为临床用的抗结核药。常需于其它抗结核药联合应用，可以增强疗效和减少耐药性。

条件下较易脱羧，生成间氨基酚，失去活性。（3）对氨基水杨酸钠水溶液不稳定，露置日光下或遇热，脱羧生成间氨基酚，再被氧化生成棕色的联苯醌类化合物，颜色渐变深。

用途：抗结核药。需于其它抗结核药联合应用，可以增强疗效和减少耐药性。

3. 盐酸乙胺丁醇（Ethambutol Hydrochloride）

化学名：(2R, 2'R)-2, 2'-[(1S, 2S)-2-(2-乙二基二氨基)-1, 2-乙二基二亚氨基]-双-1-丁醇二盐酸盐

性质：（1）盐酸乙胺丁醇为白色结晶性粉末，略有引湿性，极易溶于水。（2）分子中有两个手性碳原子，因为分子的对称性，有右旋体、左旋体、和内消旋体三种旋光异构体。药用为其右旋体，右旋体的活性为消旋体的16倍。（3）盐酸乙胺丁醇水溶液，加硫酸铜试液，再加氢氧化钠试液，生成络合物显深蓝色。

用途：盐酸乙胺丁醇为二线抗结核药，用于其它抗结核药治疗无效的病例，需于其它抗结核药联合应用，可以增强疗效和减少耐药性。

二、抗结核抗生素

抗结核抗生素主要有氨基糖苷类的链霉素（Streptomycin）、卡那霉素（Kanamycin）、利福霉素（Rifamycins）、环丝氨酸（Cycloserin）、紫霉素（Viomycin）、卷曲霉素（Capreomycin）等。（链霉素（Streptomycin）、卡那霉素（Kanamycin）见抗生素章）。利福霉素（Rifamycins）是用链丝菌发酵产生的抗生素，其化学结构为大环内酰胺。天然的利福霉素抗菌作用弱，口服吸收差。目前临床上使用的利福霉素类药物是其半合成衍生物，例如利福平（Rifampicin）、利福定（Rifandin）、利福喷丁（Rifapentine）。利福平（Rifampicin, Rifampin）化学名：3-[[（4-甲基-1-哌嗪基）亚氨基]甲基]-利福霉素，又名甲哌利福霉素。主要用于肺结核和其它结核病，也可用于麻风

病等。利福定（Rifandin）又名异丁哌利福霉素，抗菌谱与利福霉平相似，主要用于肺结核和其它结核病，也可用于麻风病等。利福喷丁（Rifapentine）又称环戊哌利福霉素，抗菌谱与利福霉平相似，与其它抗结核药联用，主要用于治疗结核病。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