

药理学抗菌药

一、抗菌药物概述

一) 化学治疗概念

- 1、**化学治疗**: 针对病原微生物、寄生虫感染及恶性肿瘤的药物治疔。
- 2、**抗菌药物**: 对病原微生物具有克制和杀灭作用, 用于防治细菌性感染疾病的药物
- 3、**抗生素**: 由微生物(如细菌, 真菌, 放线菌)所产生的能克制和杀灭病原微生物的化学物质

4、抗菌谱:药物克制或杀灭病原微生物的范围

窄谱抗菌药:仅对单一菌种或一属细菌有作用的药物

广谱抗菌药:抗菌范围广泛,对两菌,四体,一虫等都有作用的药物

抗菌活性:药物克制或杀灭病原微生物的能力

MIC:克制培养基内细菌生长的最低浓度

MBC:杀灭培养基内细菌的最低浓度

抑菌药:有克制微生物生长,繁殖能力的药物

杀菌药:有杀灭微生物能力的药物

化疗指数(CI):LD₅₀与ED₅₀之比

CI愈大,该药治疗效果愈大,对机体毒性愈

LD₅₀:动物半数死亡的剂量

ED₅₀:病原体感染动物半数有效的剂量

二、抗菌药物分类

- 1、作用于G⁺菌药 如青霉素和头孢菌素
如红霉素； 如林可霉素
如磺胺类和TMP
- 2、作用于G⁻菌药 如氨基苷类
氟喹诺酮类
- 3、广谱抗菌药 如四环素类、氯霉素等
如利福平
- 4、抗真菌药 如制霉菌素和两性霉素B
- 5、抗病毒药

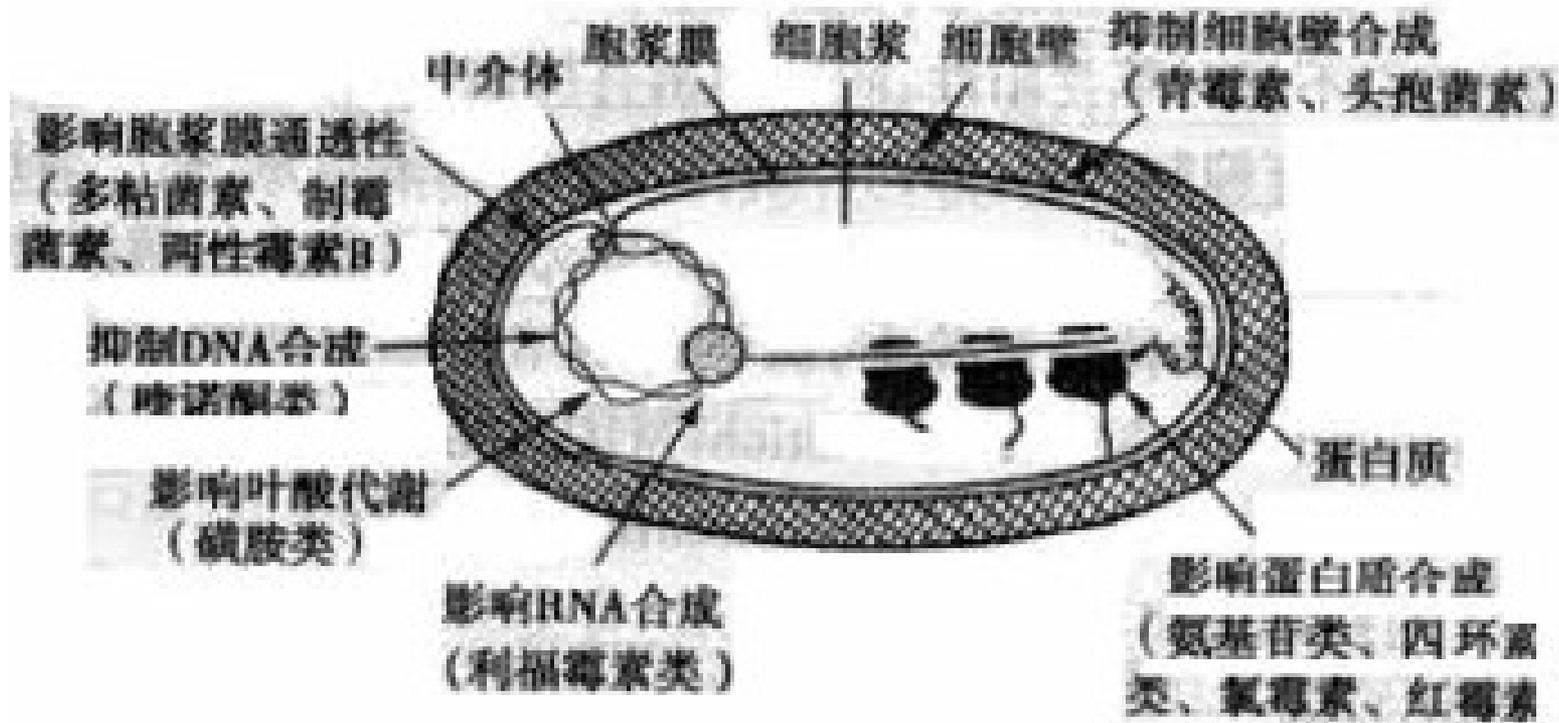


图 37-2 细菌结构与抗菌药作用部位示意图

β -内酰胺类抗生素

分类

1、青霉素类抗生素

1)天然青霉素 如青霉素

2)半合成青霉素 如氨苄西林,羧苄西林等

2头孢菌素类抗生素 如头孢氨苄,头孢曲松等

3非经典 β -内酰胺类抗生素 如硫霉素类等

青霉素G(苄青霉素)

理化性质

1母核：6-APA

2药物晶粉性质稳定

3水溶液不稳定,易被酸、碱、醇、金属离子等分解破坏,室温中可分解失效 (溶液应在临用前配制)

药动学

1不耐酸;采用肌肉注射、iv

2分布范围广泛

3几乎全部以原型经尿排泄

(可与丙磺舒合用减慢排泄)

抗菌机制

青霉素与细菌细胞壁上的青霉素结合蛋白(PBPs)结合，克制细菌细胞壁粘肽合成酶的活性，阻碍细胞壁粘肽的合成，使细菌细胞壁缺损，菌体膨胀裂解死亡。

(为繁殖期杀菌药)

抗菌谱

1细菌：G⁺球、杆菌和G⁻球菌

2螺旋体

3对阿米巴原虫、立克次体、真菌及病毒无效

(为窄谱抗生素)

耐药性：

临床用途

1治疗敏感的G+及G-菌引起的 感染性疾病(为首选药)

2治疗螺旋体引起的感染(为首选药)

不良反应

1注射局部反应

2过敏反应

预防措施:1) 详细询问病史, 过敏史等 2) 皮肤过敏试验 3) 溶液即配即用 4) 作好急救措施

3赫氏反应(治疗矛盾)

4高血钾,高血钠症

半合成青霉素

耐酸青霉素类

代表药:青霉素 V,非奈西林等

特点

- ✧ 耐酸,口服有效
- ✧ 不耐酶
- ✧ 抗菌谱与青霉素G相同
- ✧ 抗菌活性弱于青霉素G

耐酶青霉素类

代表药:苯唑西林,双氯西林等

特点

- ✌️耐酸,耐酶可口服
- ✌️对G+菌作用不及青霉素G
- ✌️主要用于耐青霉素G的金葡菌感染
- ✌️不良反应仅有胃肠道反应

广谱青霉素类

代表药:氨苄西林,阿莫西林等

特点

- 抗菌谱广,对G⁺和G⁻菌都有杀菌作用
- 耐酸可口服
- 不耐酶,对耐药金葡菌感染无效
- 氨苄西林主要治疗伤寒,副伤寒
- 阿莫西林主要治疗慢性支气管炎

抗绿脓杆菌广谱青霉素类

代表药:羧苄西林等

特点

- ↪ 不耐酸,口服无效
- ↪ 抗菌谱广,对G⁺和G⁻菌都有杀菌作用
- ↪ 对绿脓杆菌及变形杆菌作用较强
- ↪ 对肾脏毒性较小
- ↪ 合用烧伤病人绿脓杆菌干扰的治疗

头孢菌素类抗生素

作用机制

与青霉素相同

母核：7-ACA

各代抗菌特点

一代头孢菌素的特点

☆对G+菌作用强于二、三代,对G-菌作用弱于二、三代

☆对青霉素酶的稳定性较差

☆对肾有一定的毒性

☆主要用于轻中度感染

二代头孢菌素的特点

- ⌚ 对G+菌作用与一代相同或稍差,对G-菌的作用强于一代
- ⌚ 对绿脓杆菌无效
- ⌚ 对青霉素酶的稳定性较高
- ⌚ 对肾脏基本无毒
- ⌚ 主要治疗敏感菌引起的呼吸道、胆道、尿路等感染

三代头孢菌素的特点

- ⌚ 对G-菌作用较强,对G+菌作用弱于一、二代
- ⌚ 部分对绿脓杆菌有效(头孢他啶)
- ⌚ 血浆半衰期长,体内分布范围广,组织穿透力强,可透入房水,胆汁,血脑屏障,前列腺等
- ⌚ 对青霉素酶有较高的稳定性
- ⌚ 对肾脏无毒性
- ⌚ 主要治疗尿路感染及危及生命的败血症,脑膜炎等严重感染.

不良反应

与青霉素相同

- 1、口服制剂有胃肠道反应
- 2、过敏反应(与青霉素类有交叉过敏现象)
- 3、肾毒性
- 4、二重感染

以上内容仅为本文档的试下载部分，为可阅读页数的一半内容。如要下载或阅读全文，请访问：<https://d.book118.com/345010132203011323>