

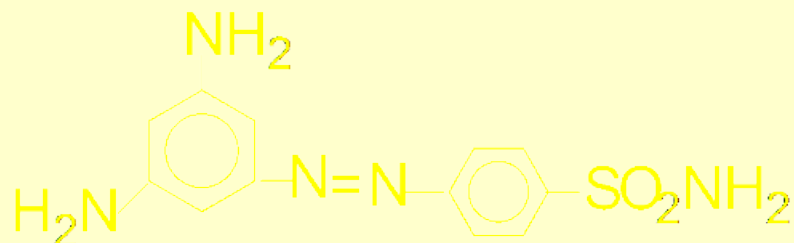
关于抗菌药和抗病毒



一、磺酰胺类

(一)、磺胺类的发展

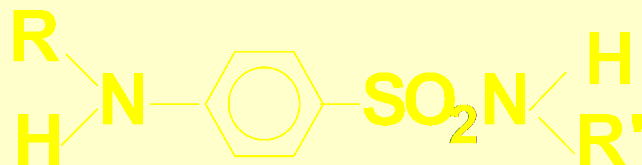
百浪多息



对氨基苯磺酰胺 (SN)



磺胺类药物



(二)、磺胺类抑菌机制

二氢蝶啶焦磷酸酯 + 对氨基苯甲酸(PABA)

↓ 二氢叶酸合成酶

磺胺类

→ 二氢叶酸(FAH_2)

↓ 二氢叶酸还原酶

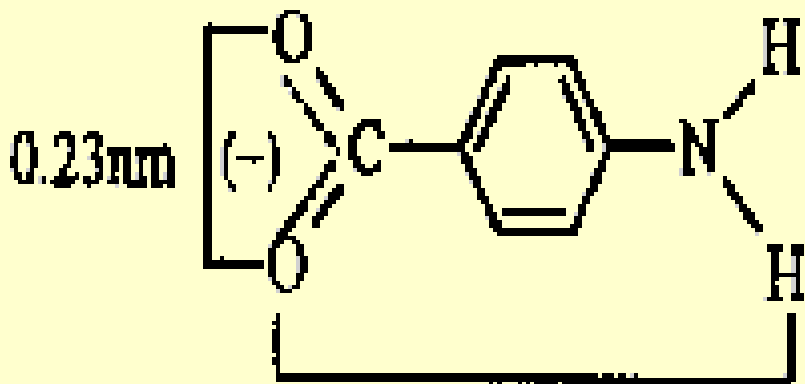
甲氧苄氨嘧啶(TMP)

→ 四氢叶酸(FAH_4)

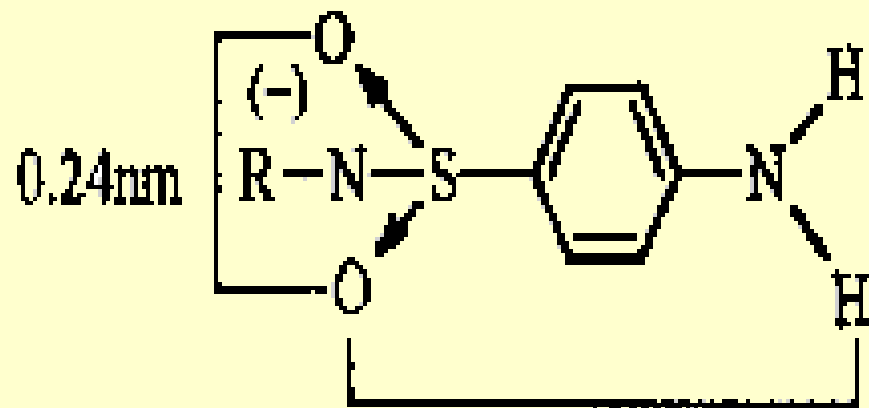
↓ 辅酶F

↓ DNA

磺胺类药物与PABA竞争性拮抗

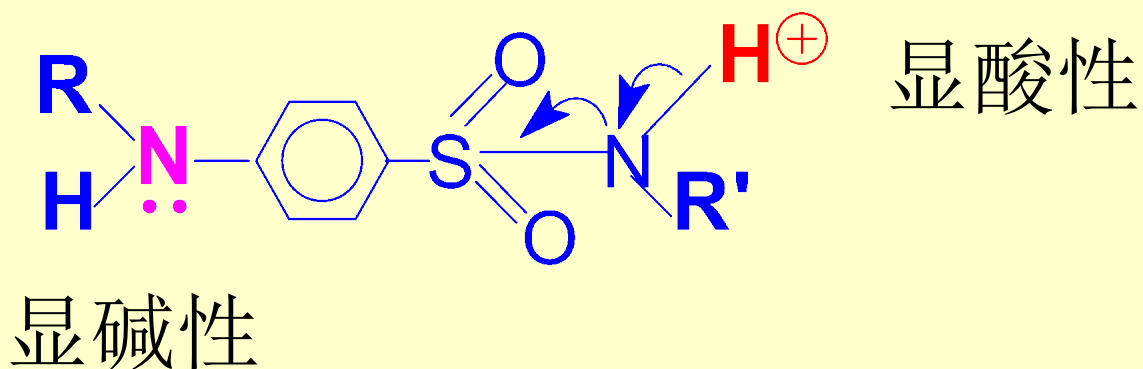


对氨基苯甲酸
(PABA)



磺胺类药物

(四)、磺胺类为两性物质



pH3~ 5 析出磺胺药

(五)、磺胺类药物吸收与代谢

小肠吸收

大部分4-氨基的乙酰化代谢，

(六)、磺胺类重点药物

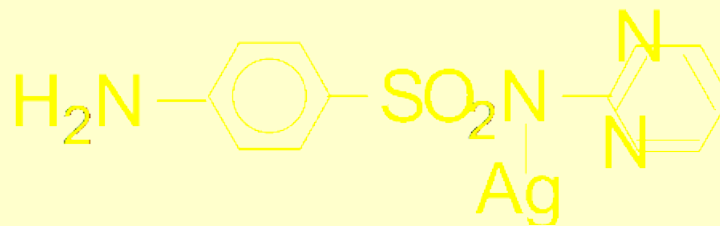
1、磺胺嘧啶类

(1)、2-氨基磺胺嘧啶

磺胺嘧啶 (SD) 中效



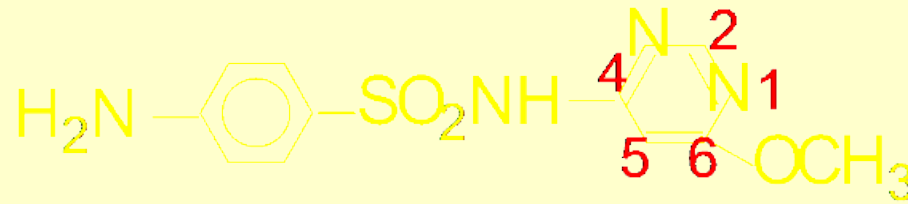
磺胺嘧啶银 (SD-Ag)



外用消炎药

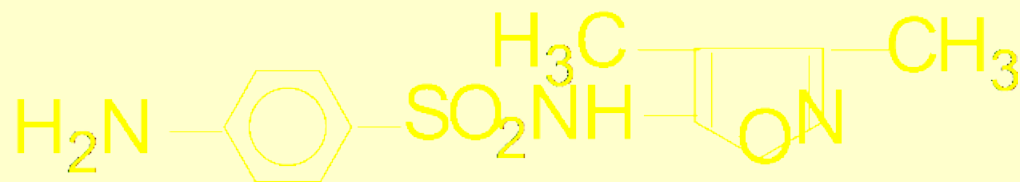
(2)、4-氨基磺胺嘧啶

磺胺莫托辛 (SMM) 长效

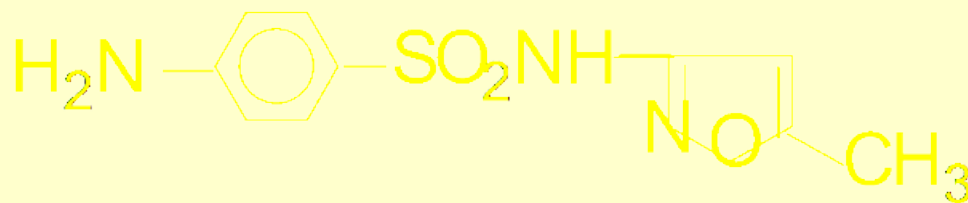


2、磺胺噁唑类

磺胺异噁唑 (SIZ) 短效



磺胺甲噁唑 (SMZ) 短效



(七)、磺胺类药物合成

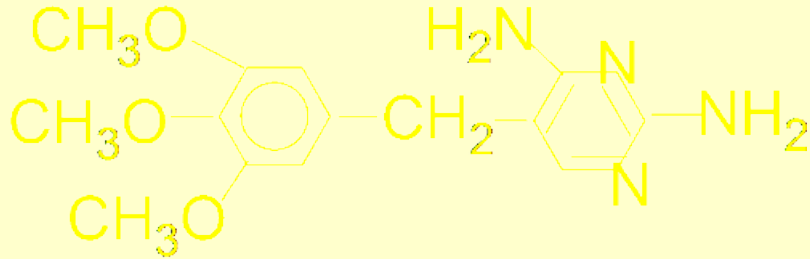
磺胺甲噁唑 (SMZ)的合成p282

采用磺胺类药物合成通法：

用对-乙酰氨基苯磺酰氯 (ASC)与相应的杂环缩合。

二、磺胺增效剂 (TMP)

甲氧苄氨嘧啶(TMP)



(一)、作用机制

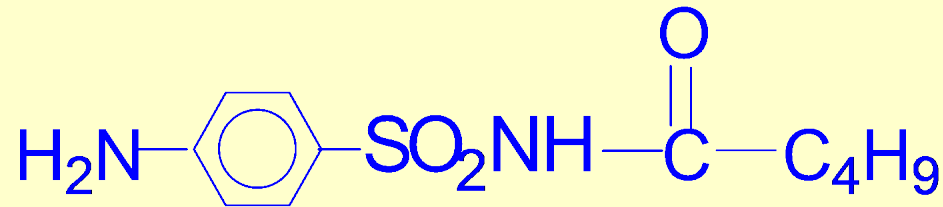
阻止二氢叶酸向四氢叶酸的转化

与磺胺类药物合用可增强磺胺药物活性

复方新诺明 (SMZ+TMP)

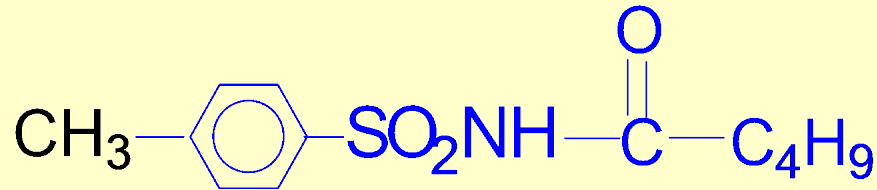
三、磺酰脲类降血糖

氨磺丁脲



毒性大

甲苯磺丁脲



格列本脲 p288

长效，口服

喹诺酮类抗菌药

一、药物发展与分类

萘啶酸类

第一代 1962-1969

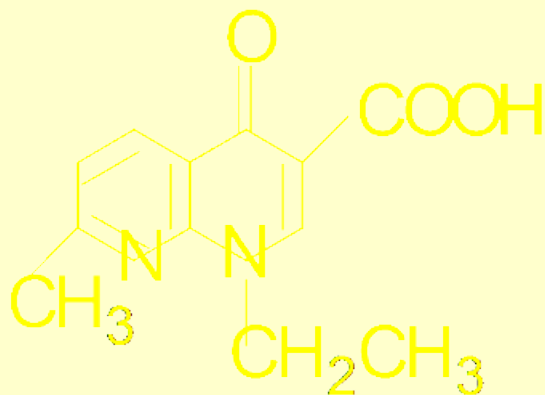
萘啶酸

抗菌能力

结构特点

G⁻(+) G⁺(-)

绿脓杆菌(-)



吡啉并嘧啶羧酸类

第二代 1970-1977

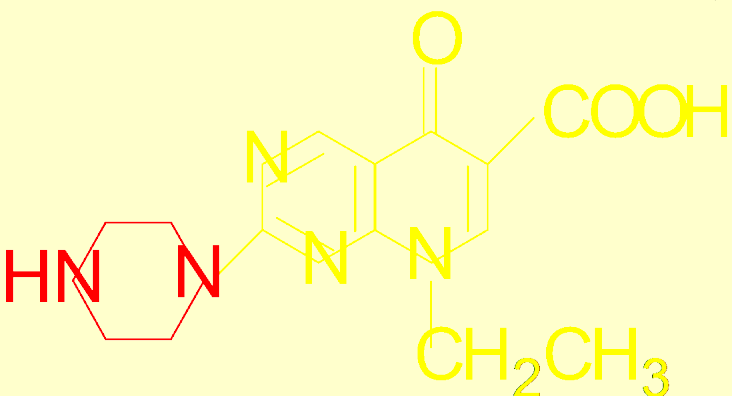
吡哌酸

抗菌能力

结构特点

G⁻(+) G⁺(-)
绿脓杆菌(+)

7-位增加
哌嗪基团



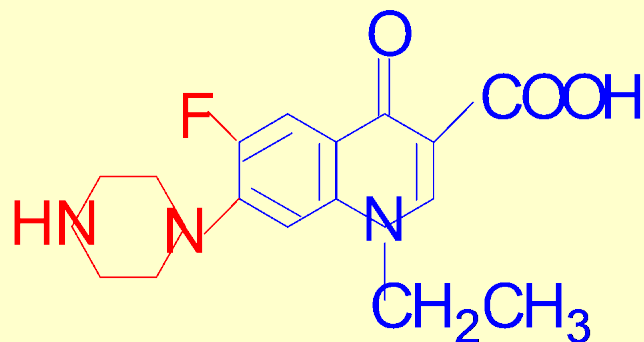
喹啉羧酸类

第三代 1978--

氟哌酸

抗菌能力

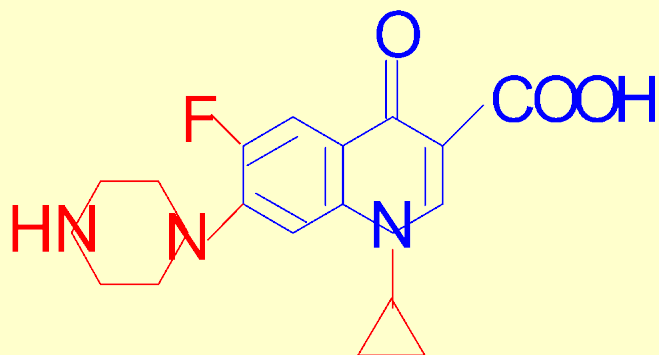
结构特点



G⁻(+) G⁺(+)
绿脓杆菌(+)

7-哌嗪基；
6-位引入F原子

环丙沙星



抗菌活性更强

二、喹诺酮类药物作用机制

1大肠杆菌的DNA回旋酶由2个A亚单位和2个B亚单位组成。

1喹诺酮类药物是回旋酶抑制剂

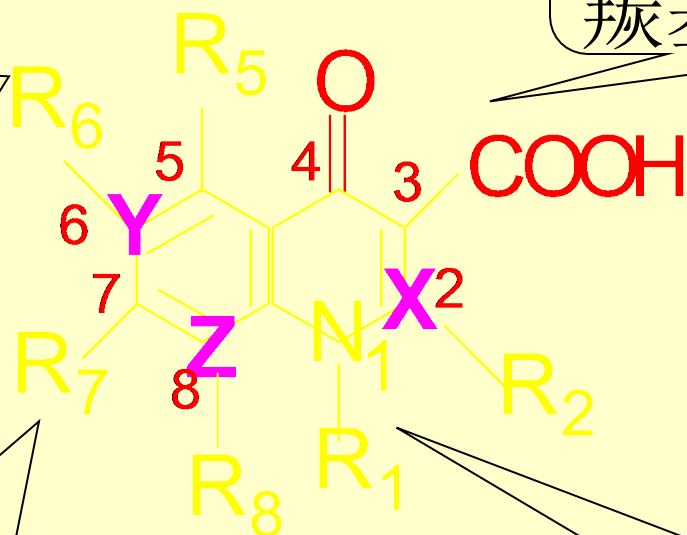
1影响因素①抑菌强度;②穿透细胞能力

	A亚单位	B亚单位	穿透力
萘啶酸类 (一代)	(+)	(-)	弱
吡啶并嘧啶羧酸类(二代)	(+)	(+)	弱
喹啉羧酸类 (三代)	(+)	(+)	强

三、喹诺酮类构效关系

6-位引入F
结合力↑
穿透力↑

3位羧基和4位的
羰基为必须结构

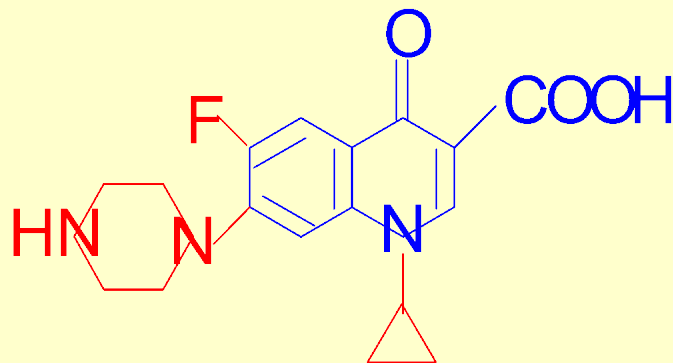


N1取代基应为
乙基或其电子
等排体



药物合成

环丙沙星 p296



三、抗真菌药

真菌可引起皮肤、粘膜、皮下组织和内脏感染



浅表真菌病

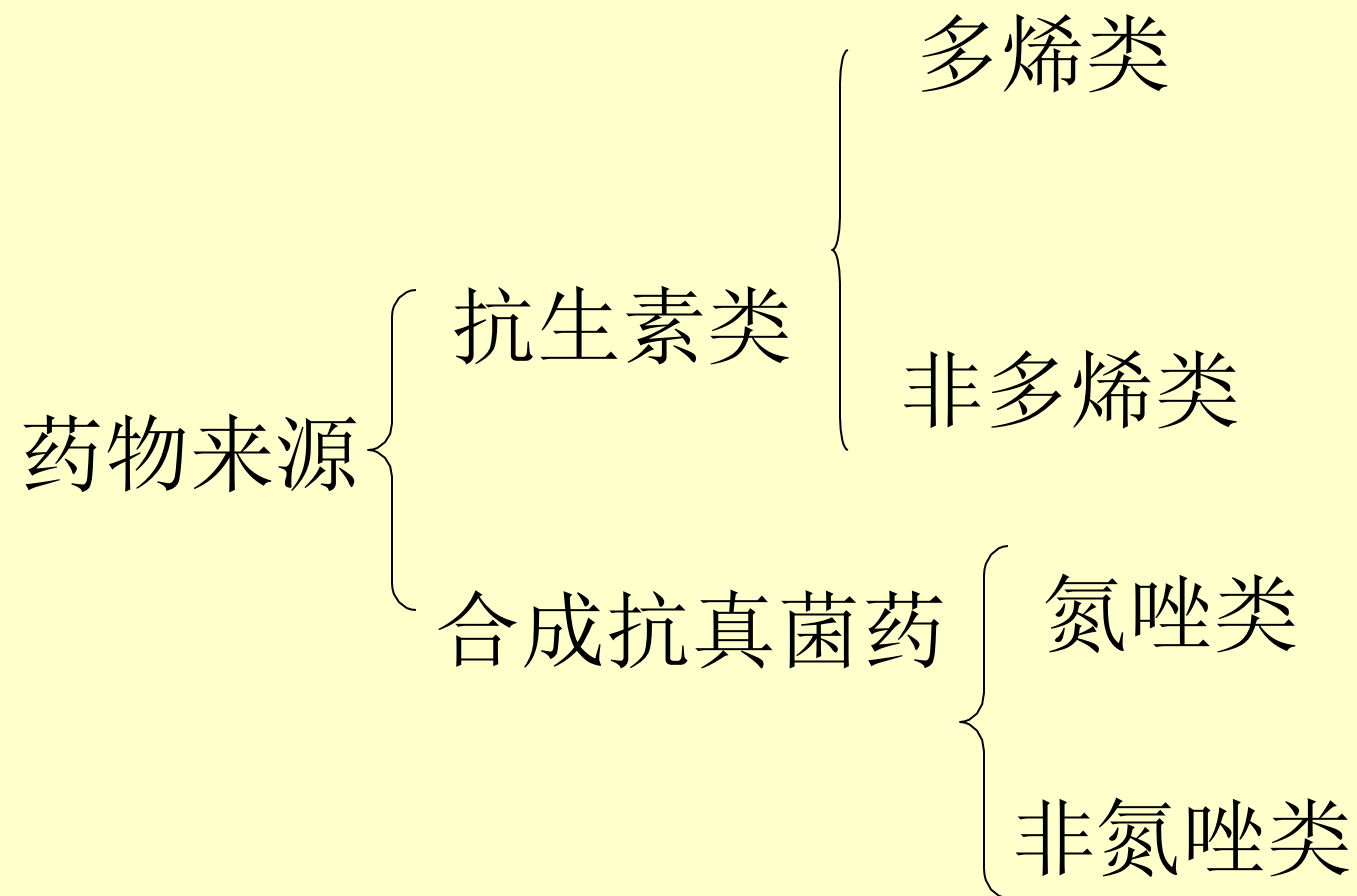


深部真菌病

白色念珠菌等

传染性强
占90%

表皮---皮癣
毛发---头屑
指甲--灰指甲



(一)、抗生素类抗真菌药

多烯类：P401

两性霉素B

制霉菌素

多用于深部感染

非多烯类：

灰黄霉素

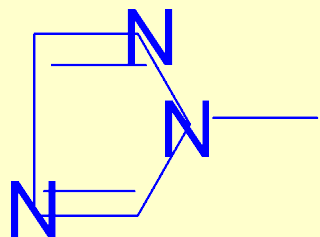
对皮肤浅部真菌，多外用

作用机制：

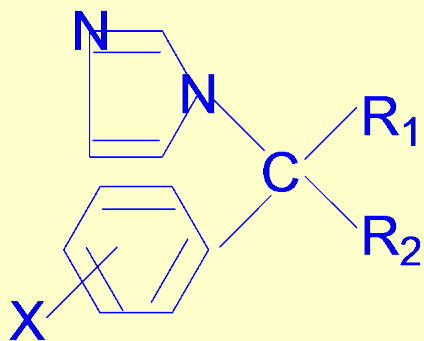
多烯类与麦角甾醇结合→ 损伤膜通透性→
破坏正常代谢→ 抑制生长

(二)、合成抗真菌药

1、氮唑类



三氮唑环

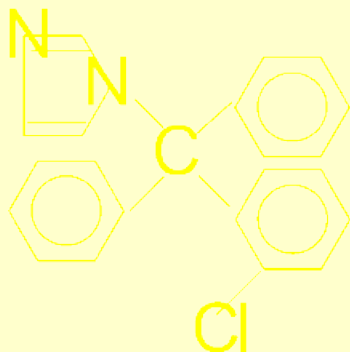


1-2个咪唑环

1位氮与芳烃连接

1或2卤取代

克霉唑



联苯苄唑 (孚琪) p298(12-37) 渗透强，长效

咪康唑 (达克宁) p298(12-39) 广谱抗真菌药

替硝唑 p299(12-42)

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/675031124030011200>