

## 第三十一章 抗生素

**$\beta$ -内酰胺类抗生素**系指化学结构中具有 $\beta$ -内酰胺环基团的一类抗生素。包括**青霉素类、头孢菌素类**、其基本结构前者为6-氨基青霉烷酸（6-APA，后者为7-氨基头孢烷酸（7-ACA）。

**作用机制：**主要是抑制细菌细胞壁的生物合成。

## $\beta$ 内酰胺类的抗菌机制:

1. **抑制转肽酶活性**，阻止黏肽的交叉连接，使细菌细胞壁缺损，水分内渗，菌体膨胀、破裂、死亡。其作用靶位是青霉素结合蛋白（PBPs）。
2. **激发细菌自溶酶（autolysins）活性**，促进菌体裂解死亡。

## 【耐药机制】

① 产生水解酶。② 缺乏自溶酶。使菌体自溶减少。③  $\beta$  内酰胺酶与药物结合。使之停留在胞浆膜外而不能到达作用靶位（PBP<sub>s</sub>）发挥抗菌作用。④ 改变菌膜通透性。使该类抗生素不能进入菌体内。⑤ 加速药物外排。⑥ 改变PBP<sub>s</sub>。使  $\beta$  内酰胺类对PBP<sub>s</sub>亲和力降低。

## 第二节 大环内酯类、林可霉素类

是一类具有14~16碳大环内酯环相同化学结构的抗菌药。

**药物：**

**第一代：**红霉素、螺旋霉素、麦迪霉素、交沙霉素、**第二代**罗红霉素、克拉霉素、阿奇霉素

阿奇霉素  
第

**特点：**

主要用于需氧G<sup>+</sup>、G<sup>-</sup>球菌和厌氧球菌等感染，对β-内酰胺类抗生素过敏或耐药患者的治疗。

## 红霉素 (erythromycin)

### 【体内过程】

红霉素不耐酸，口服吸收少，故现用制剂为肠溶片或酯化物（依托红霉素/无味红霉素），其抗酸，口服吸收好。乳糖红霉素供i. v。

## [抗菌作用]

1. 对G<sup>+</sup>菌、G<sup>-</sup>菌和厌氧菌敏感；

2

## [抗菌机制]

与细菌核蛋白体50s亚基P位结合，抑制转肽作用和抑制mRNA移位，而阻碍蛋白质合成

## [耐药性]

金葡菌对红霉素易产生耐药性，且与其他大环内酯类药物有完全交叉耐药性。

**原因：** ●靶位改变； ●产生水解酶；  
●促进主动外排系统等。

## [临床应用]

1. 军团菌病、空肠弯曲菌肠炎、白喉带菌者、支原体肺炎等首选。
2. 耐药金葡菌感染及对青霉素过敏者。
3. G<sup>+</sup>球菌感染：如大叶肺炎、扁桃体炎、猩红热、丹毒、急性中耳炎或鼻窦炎等。  
(疗效不及P-G)。



## [不良反应]

1. 消化道反应及伪膜性肠炎
2. 血栓性静脉炎：i. v其乳糖酸盐常见。
3. 肝脏损害：依托红霉素或乙琥红霉素易引起（转氨酶升高、肝肿大、胆汁郁积型黄疸），停药可恢复，肝功能不良者禁用。

# 阿奇霉素

与红霉素比较具有以下特点：

- ① 对肺炎支原体的作用最强，抗流感杆菌和淋球菌、弯曲菌也有效。
- ② 对金黄色葡萄球菌、肺炎球菌、链球菌的抗菌活性较弱。
- ③ 不良反应发生率较低，有胃肠道反应及偶可见肝功能异常与外周白细胞下降等。

主要用于呼吸道感染、衣原体引起的泌尿道感染和宫颈炎等。

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/935243143113011240>