

药物 化学

Medicinal Chemistry

主 编 闵犁园

副主编 谭艳霞 叶文淳



云南大学出版社
YUNNAN UNIVERSITY PRESS

2642379

R914
50

药 物 化 学

主 编：闵犁园

副主编：谭艳霞 叶文淳

参 编：姚 波 郑孝英 张云梅



 云南大学出版社

8785438

图书在版编目 (CIP) 数据

药物化学 / 闵犁园主编. —昆明: 云南大学出版社, 2011

ISBN 978 - 7 - 5482 - 0738 - 2

I. ①药… II. ①闵… III. ①药物化学 IV. ①R914

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2011) 第 252624 号

药物化学

主 编 闵犁园

副主编 谭艳霞 叶文淳

责任编辑: 朱光辉 赵红梅

封面设计: 刘 雨

出版发行: 云南大学出版社

印 装: 昆明理工大学印务包装有限公司

开 本: 787mm × 1092mm 1/16

印 张: 12.5

字 数: 250 千

版 次: 2012 年 1 月第 1 版

印 次: 2012 年 1 月第 1 次印刷

书 号: ISBN 978 - 7 - 5482 - 0738 - 2

定 价: 26.00 元

地 址: 昆明市翠湖北路 2 号云南大学英华园内

邮 编: 650091

发行电话: 0871 - 5031071 5033244

前 言

本书是由昆明冶金高等专科学校“药物化学”编写组结合我校的专业培养方案及教学大纲编写完成的，适用于高职高专药学类、制药类及相关专业教学使用。

我校人才培养模式的基本特征是以服务为宗旨，以就业为导向，以适应行业发展和岗位需要为目标，以培养技能型、应用型人才为根本，重点是培养学生的职业技能和职业素养，以增强学生的就业竞争力和发展潜力。

《药物化学》的编写以理论知识为主，由浅入深，实用、够用为度，以突出职业教育特色确定本教材的总体编写框架和内容。

在整门课程内容编排上，首先提出了教学要求，其次对各类药物的发展作了简单介绍和分类，每小节按分类来讲，概述了其作用机制、构效关系、代表性药物的理化性质、合成及临床应用。绪论中主要说明药物化学的研究对象、任务，介绍药物化学的发展历史、发展方向及药物的命名。第二章至第十三章依次是抗生素、抗菌药物、中枢神经系统药物、麻醉药物、抗炎药物、抗过敏药物、消化系统药物、抗结核与抗病毒药物、抗肿瘤药物、激素、心血管系统药物、拟肾上腺素和抗肾上腺素药物等主要内容。第十四章介绍了新药的研究和开发过程。第十五章为药物化学实验部分，以巩固学生对理论知识的理解，加强动手能力，使学生毕业后能够尽快成为服务于第一线工作的高级技术应用型人才。

本书在编写过程中借鉴和参考了大量的参考文献及相关教材，许多老师提出了宝贵的建议，同时得到了编者所在院校的大力支持，在此一并表示感谢。

限于编者水平及时间的仓促，疏漏和不妥之处不可避免，恳请广大师生及同行提出宝贵意见。

编者

2011年10月

目 录

第一章 绪论	(1)
第一节 药物化学的起源与发展	(2)
第二节 药物的结构与药效关系	(4)
第三节 药物的命名	(7)
第二章 抗生素	(10)
第一节 青霉素类抗生素	(13)
第二节 头孢菌素类抗生素	(16)
第三节 其他类抗生素	(19)
第三章 抗菌药物	(23)
第一节 合成抗菌药物	(23)
第二节 抗真菌药物	(31)
第四章 中枢神经系统药物	(33)
第一节 镇静催眠药物	(33)
第二节 抗癫痫药物	(39)
第三节 中枢兴奋药	(45)
第四节 镇痛药	(48)
第五章 麻醉药物	(55)
第一节 全身麻醉药物	(56)
第二节 局部麻醉药物	(60)
第六章 抗炎药物	(64)
第一节 解热镇痛药物	(64)
第二节 非甾体抗炎药物	(68)
第七章 抗过敏药物	(78)
第一节 组胺 H_1 受体拮抗剂	(79)
第二节 其他抗过敏药物	(87)
第八章 消化系统药物	(89)
第一节 抗溃疡药物	(89)

第二节	止吐药物和催吐药物	(93)
第三节	促动力药物	(97)
第九章	抗结核与抗病毒药物	(100)
第一节	抗结核病药物	(100)
第二节	抗病毒药物	(103)
第十章	抗肿瘤药物	(107)
第一节	生物烷化剂	(107)
第二节	金属铂配合物	(114)
第三节	天然抗肿瘤药物	(116)
第十一章	激素	(123)
第一节	前列腺素	(125)
第二节	甾体激素	(128)
第十二章	心血管系统药物	(134)
第一节	抗心律失常药物	(134)
第二节	抗心绞痛药物	(139)
第三节	强心药物	(142)
第四节	抗高血压药物	(147)
第五节	降血脂药物	(159)
第十三章	拟肾上腺素和抗肾上腺素药物	(164)
第一节	拟肾上腺素药物	(164)
第二节	抗肾上腺素药物	(168)
第十四章	新药研究与开发概论	(173)
第一节	新药设计的基本途径和方法	(174)
第二节	计算机辅助药物设计	(177)
第十五章	药物化学实验	(179)
实验一	乙酰水杨酸(阿司匹林)的合成	(179)
实验二	阿司匹林的性质实验	(183)
实验三	扑热息痛的合成(Synthesis of Paracetamol)	(185)
实验四	磺胺醋酰钠(Sulfacetamide Sodium)的合成	(187)
实验五	从茶叶中提取咖啡因	(191)

第一章 绪 论

【教学要求】

- (1) 了解药物化学的研究内容和发展方向；
- (2) 了解药物的构效关系；
- (3) 熟悉中国药品通用名及商品名的作用及命名要求。

药物化学 (Medicinal Chemistry) 是利用化学的概念和方法发现、确证和开发药物, 从分子水平上研究药物在体内的作用方式和作用机理的一门学科。药物化学是建立在化学和生物学基础上, 对药物结构和活性进行研究的一门学科。研究内容涉及发现、修饰和优化先导化合物, 从分子水平上揭示药物及具有生理活性物质的作用机理, 研究药物及生理活性物质在体内的代谢过程。

药物化学这门学科的任务包括: 研究药物的化学结构和活性间的关系 (构效关系); 药物化学结构与物理化学性质的关系; 阐明药物与受体的相互作用; 鉴定药物在体内吸收、转运、分布的情况及代谢产物; 通过药物分子设计或对先导化合物的化学修饰获得新化学实体创制新药。药物化学的研究对象包括药物 (drug) 及与其相关联的物质和一般生理活性物质, 主要研究对象是药物。其主要研究内容包括两点: (1) 已知药理作用并在临床上应用的药物, 包括它们的制备方法、分析确证、质量控制、结构变换以及化学结构和药理活性之间的关系。(2) 从生物学和化学角度设计和创新药物, 主要研究药物与生物体相互作用的物理化学过程, 从分子水平上揭示药物的作用机理和作用方式。

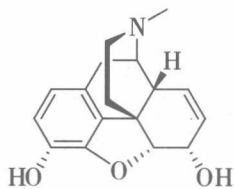
药物化学是一门发现与发明新药、合成化学药物、阐明药物化学性质、研究药物分子与机体细胞 (生物大分子) 之间相互作用规律的综合性学科, 是药学领域中重要的带头学科。药物化学是一门历史悠久的经典科学, 具有坚实的发展基础, 积累了丰富的内容, 为人类的健康作出了重要的贡献。

第一节 药物化学的起源与发展

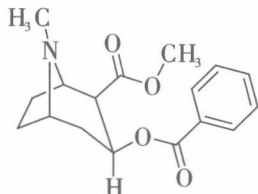
人类在原始社会主要依靠采食植物和渔猎维持生活，他们在寻找食物的过程中，难免误食有害的“食物”以致产生呕吐、腹泻等反应甚至中毒，偶然也因吃了某些“食物”而使原有的腹痛、便秘等病痛得到缓解。通过长期实践经验的积累，人们逐渐对有关自然产物的药效或毒性有了一定的了解，搜集整理并在觅食时有意识地辨别、选择，以避免中毒或用以解除某些病症，药物就因此而产生。有关神农“尝百草之滋味，一日而遇七十毒”的传说，生动而形象地反映了人们认识药物的过程。古人通过反复积累，从无意识的偶然体验，到有意识的试验、观察，逐步形成了最初的药物知识。

近代药物化学起源于 19 世纪初，当时从阿片中提纯了吗啡，从古柯叶中得到了可卡因，为“药物化学”的形成奠定了基础；19 世纪中期，发现水合氯醛的镇静作用及乙醚的麻醉用途；1827 年，英国科学家拉罗克斯首先发现柳树含有一种叫水杨甙的物质；1853 年，德国化学家杰尔赫首次合成水杨酸盐类的前身——水杨酸，它具有退热止痛作用；1897 年，另一位德国化学家霍夫曼为解除父亲的风湿病之苦，将纯水杨酸制成乙酰水杨酸，这即是沿用至今的阿斯匹林；1899 年，德国化学家拜耳创立了以工业方法生产阿斯匹林的工艺，并作为解热镇痛药上市，并且沿用至今。值得一提的是，阿斯匹林是人类历史上第一个用化学方法对天然产物进行结构改造而得到的药物。

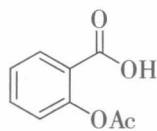
进入 20 世纪后，药物化学得到了飞速的发展。神经系统药物如麻醉药、镇静药、镇痛药、解热镇痛药等重要药物已广泛使用；构效关系研究也开始在药物化学中兴起（从天然药物化学成分中寻找起作用的“药效基团”，并对复杂的天然化合物进行结构修饰以寻找天然化合物的简化结构药用类似物）；可卡因经过药效基团寻找，发展出一系列局部麻醉药，如普鲁卡因等。



吗啡



可卡因



阿斯匹林

20 世纪 30 年代以后，药物化学与实验药理学的紧密结合，形成了新药研究的一套完整的系统，从而大大加快了药物开发进度。磺胺类药物的发现，使 Ehrlich 创导的化学治疗药的研究有了重要的进展，促使药物化学理论研究特别是药

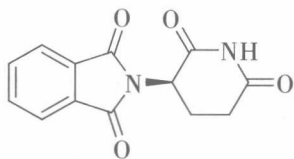
物结构修饰有了新的发展,并在此基础上总结出电子等排原理、立体选择原理等。青霉素是第一个被发现的抗生素,四环素、链霉素、氯霉素、红霉素等类型的抗生素相继问世,是药物化学对人类的重要贡献,特别是链霉素的发现,使得当时人们谈虎色变的结核病得以攻克。

20 世纪中后期,药物化学的发展和大量新药上市,归纳为三方面的主要原因:生命科学,如结构生物学、分子生物学、分子遗传学、基因学和生物技术的发展,为发现新药提供理论依据和技术支撑;信息科学的突飞猛进,如生物信息学的建立,生物芯片的研制,各种信息数据库和信息技术的应用,可便捷地检索和搜寻所需要的文献资料,研究水平和效率大为提高;制药企业为了争取国际市场,投入大量资金用于新药研究和开发。

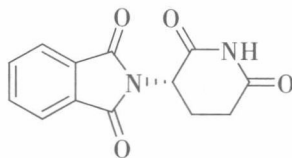
不久我们将迎来知识经济的新世纪,知识创新、技术创新、促进科技进步和经济发展将是面临的主要任务,生命科学和信息科学将日益得到发展,成为下世纪的活跃领域,这为防病治病、新药研究提供了重要的基础。药物化学与生物学科、生物技术紧密结合,相互促进,仍是今后发展的大趋势。

药物化学的发展也不是一帆风顺的。人类发明的化学药物,既给人类带来了极大的益处,但也给自己造成了意想不到的伤害,对化学药物的盲目依赖和滥服药物,已造成了许多不应有的悲剧,其中最典型的案例就是反应停事件。沙利度胺最早由德国格仑南苏制药厂开发,1957 年首次被用作处方药。沙利度胺推出之始,科学家们说它能在妇女妊娠期控制精神紧张,防止孕妇恶心,并且有安眠作用。因此,此药又被叫做“反应停”。20 世纪 60 年代前后,欧美至少 15 个国家的医生都在使用这种药治疗妇女妊娠反应,很多人吃了药后的确就不吐了,恶心的症状得到了明显的改善,成了“孕妇的理想选择”。于是,“反应停”被大量生产、销售,仅在联邦德国就有近 100 万人服用过“反应停”,“反应停”每月的销量达到了 1 吨的水平。在联邦德国的某些州,患者甚至不需要医生处方就能购买到“反应停”。但随即而来的是,许多出生的婴儿都是短肢畸形,形同海豹,被称为“海豹肢畸形”。1961 年,这种症状终于被证实是孕妇服用“反应停”所导致的。于是,该药被禁用,然而,受其影响的婴儿已多达 1.2 万名。

通过进一步的研究发现,R-(+)-沙利度胺可用于治疗孕吐,然而 S-(-)-沙利度胺却能导致胎儿畸形。



R-(+)-沙利度胺



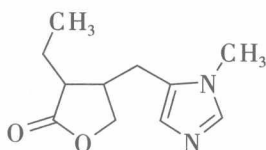
S-(-)-沙利度胺

这次事件对各国的药品安全敲响了警钟，在此之后，各国就开始制定更为严格的药品管理制度。

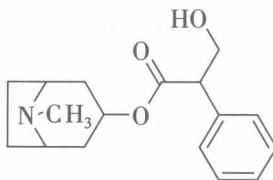
第二节 药物的结构与药效关系

药物的化学结构与药效的关系 (Structure - activity relationships, SAR), 是药物化学研究的重要任务之一。

早在 19 世纪中叶, Barnard 首先证实, 箭毒素 (Curarine) 作用于体内特定部位。这种神经肌阻断剂刺激神经后, 阻止骨骼肌的收缩, 但若直接刺激肌肉则无效。这个研究显示了药物作用于某一局部位置, 并说明在神经与肌肉之间存在间隙或突触。其后, Langley 发现毛果芸香碱 (Pilocarpine) 类化合物刺激自主神经系统的副交感神经, 具选择性, 作用极强。而阿托品 (Atropine) 能以互为专一的方式, 阻断毛果芸香碱的作用, 两个化合物作用于细胞的同一组成部分, 后来被称之为受体。19 世纪末至 20 世纪初, 著名微生物学家 Ehrlich 发现, 一些有机物能以高度的选择性产生抗微生物作用, 他认为这是由于药物与生物中某种接受物质结合的结果。他提出了接受物质 (Receptive Substance) 和受体 (Receptor) 这些名词, 并认为药物与受体相互作用犹如钥匙和锁的关系, 它们的契合导致高度专一性。



毛果芸香碱



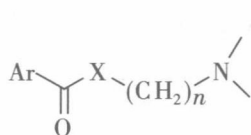
阿托品

药物分子进入体内能否产生药效, 则必须满足两个要求: 一是能到达体内受体部位; 二是与受体部位发生特定的相互作用。特异性结构药物须与受体相互作用, 形成复合物, 才能产生药理作用。决定这一过程的化学结构因素有: ①药物的基本结构; ②电子云密度的分布; ③立体结构。

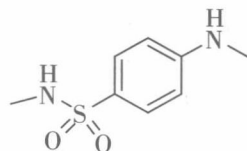
一、药物的基本结构

在药物构效关系研究中, 发现同一药理作用类型的药物能与某一特定的受体相结合, 因此它们在结构上往往具有某种相似性。这些同类药物中化学结构相同的部分称为该类药物的基本结构或药效结构 (Pharmacophore)。很多类药物都可以找出其基本结构, 如下列所示局部麻醉药、磺胺类药物、拟肾上腺素药物和

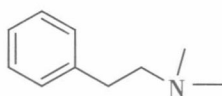
β -受体阻断药的基本结构。基本结构可变部分的多少和可变性的程度各不相同,有其结构的特异性,这与特定受体对药物分子结构的选择性有关。



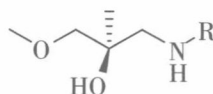
局部麻醉药的基本结构



磺胺类药物的基本结构

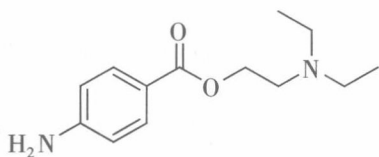


拟肾上腺素药物的基本结构

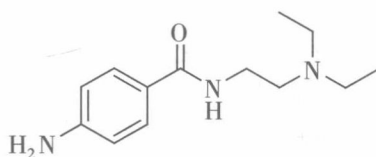


β -受体阻断药物的基本结构

基本结构的确定有助于药物的结构改造和新药设计。在药物的结构改造中,要保持其基本结构不变,以保证改造后仍具有该类药物的作用;而在非基本结构部分改变,可望得到具有各种特点的衍生物。如在磺胺类药物 N' 上的氢以杂环取代后的衍生物,使分子适度解离而活性增强,得到了易渗入脑脊髓,防治流行性脑膜炎的磺胺嘧啶,其抗菌作用约为氨苯磺胺的 600 倍。又如局部麻醉药普鲁卡因兼有抗心律失常作用,但作用时间短。对其基本结构的酯基部分以电子等排的亚氨基取代一个氧原子,合成了普鲁卡因胺。其因水解代谢慢而使作用持久,临床上已用作抗心律失常药。



普鲁卡因

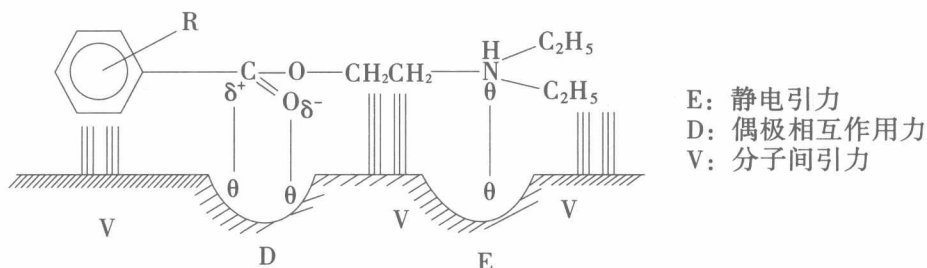


普鲁卡因胺

二、电子云密度分布对药效的影响

受体是以蛋白质为主要成分组成的具三维结构的生物大分子,其作用是在细胞间转换信号。蛋白质分子由各种氨基酸经肽键联接而成,除肽键外,氨基酸有各种极性基团,其电子云密度的分布是不均匀的:有些区域的电子云密度较高,即带有负电荷或部分负电荷,有些区域的电子云密度较低,即带有正电荷或部分正电荷。如果一个药物分子结构中的电荷分布正好与其特定受体相适应,那么药物的正电荷(或部分正电荷)与受体的负电荷(或部分负电荷)产生静电引力,

药物的负电荷（或部分负电荷）与受体的正电荷（或部分正电荷）产生静电引力，使药物与受体相互接近。当接近到一定程度时，分子的其余部分还能与受体通过范德华力相互吸引，使药物与受体结合成受体复合物。下图表示局部麻醉药分子与受体的结合模型。



三、立体结构对药效的影响

生物活性物质对生物大分子的作用部位有专一的亲和力，亲和力来自相互间结构上的互补性。结构特异性药物和受体的相互作用中有两点是重要的，即电性的互补性和立体结构的互补性。二种互补性均要求药物分子中的各基团和原子的空间排列与受体相互适合。药物分子的特定原子间距离，手性中心以及取代基空间排列的改变，均能对互补性和复合物的形成起重要影响。

1. 药物分子的手性和手性药物

有手性中心的药物，具有对映异构体，旋光性有差别；不同异构体的活性、代谢和毒性都有一定差异，含手性中心的药物称手性药物；手性药物的对映体之间药物活性的差异主要有：

(1) 对映异构体之间具有等同的药理活性和强度。如抗组胺药异丙嗪和局部麻醉药丙胺卡因。

(2) 对映异构体之间产生相同的药理活性，但强弱不同。如组胺类抗过敏药氯苯那敏，其右旋体的活性高于左旋体。

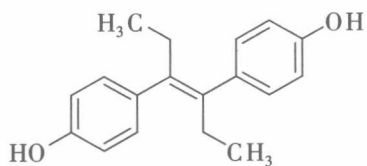
(3) 对映异构体中一个有活性，一个没有活性。如氯霉素，仅 1R, 2R - (-) 苏阿糖型化合物有抗菌活性。

(4) 对映异构体之间产生相反的活性。如利尿药依托唑啉的左旋体具有利尿作用，而右旋体则有抗利尿作用。

(5) 对映异构体之间产生不同类型的药理活性。如镇痛药丙氧芬，其右旋体产生镇痛活性，而左旋体则产生镇咳作用。

2. 药物的几何异构与官能团空间距离

双键、环等刚性结构可产生几何异构体，如己烯雌酚，其反式异构体表现出与雌二醇相同的生理活性，而顺式异构体不具雌激素活性。



反式己烯雌酚

第三节 药物的命名

常见的药物名称有通用名、化学名、商品名和别名，其中，应用范围最广的是通用名。

一、药品的通用名

中华人民共和国卫生部药典委员会编写的《中国药品通用名称（CADN）》（化学工业出版社，1997）是中国药品命名的依据。它是以世界卫生组织推荐使用的国际非专利药品名称（International Non – proprietary Names for Pharmaceutical Substance，INN）为依据，结合我国具体情况而制定的。关于 INN，它是新药开发者在新药申请时向政府主管部门提出的正式名称，不能取得专利及行政保护，任何该产品的生产者都可使用的名称，也是文献、教材、资料中以及在药品说明书中标明的有效成分的名称。在复方制剂中只能用它作为复方组分的使用名称。目前 INN 名称已被世界各国采用。如头孢塞肟钠的通用名是先锋 7 号，头孢唑肟钠的通用名是先锋 5 号等。

表 1 – 1 INN 采用的部分词干的中文译名表

英文	中文	药物类别
-cillin	西林	青霉素类
cef-	头孢	头孢菌素类
-conazole	康唑	咪康唑类
-oxacin	沙星	萘啶酸类
-vir	韦	阿昔洛韦类
-nidazole	硝唑	甲硝唑类

续表

英文	中文	药物类别
-caine	卡因	普鲁卡因
-flurene	氟烷	恩氟烷
-bufen	布芬	丁酸衍生物
-profen	洛芬	布洛芬类
-vastatin	伐他汀	洛伐他汀
-dipine	地平	硝苯地平
-oxetine	西汀	氟西汀
-olol	洛尔	普萘洛尔
-relix	瑞林	戈那瑞林
-gli	洛列	

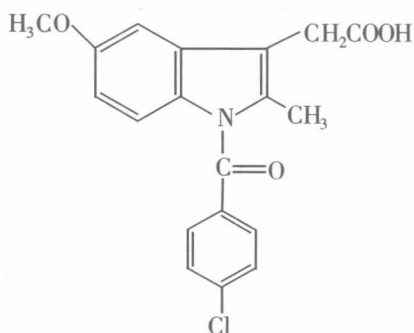
二、药物的化学名

英文化学名的命名原则现在多以美国化学文摘 (Chemical Abstracts Service, CAS) 为依据, 对药物认定其基本母核 (常常是最简单的部分), 其他部分均将其看成是取代基。英文命名中, 按基团的英文字母顺序排列。

中文化学名的命名原则可参考《英汉化学化工辞典》(科学出版社)。其中有关取代基排列先后次序问题, 中文命名法和英文命名法不一致, 需给以注意。

中文命名法中, 在母核前的基团次序应按立体化学中的次序规则进行命名, 小的原子或基团在先, 大的在后。

例如:



通用名: 吲哚美辛

化学名: 2-甲基-1-(4-氯苯甲酰基)-5-甲氧基-1H-吲哚-3-乙酸

三、药品的商品名

药品具有商品的属性。商品名是经国家药品监督管理部门批准的特定企业使用的药品名称。与药品的通用名不同，商品名可由企业经商标注册，具有专有权。

如抗生素阿奇霉素，商品名就有那琦、津博、维宏、亚思达、派芬、希舒美、抒罗康、博抗、泰力特、齐诺和舒美特等几十种。

通用名主要是用来区别药物，商品名主要是用来区别生产厂家。

商品名在使用时有很大弊端。在专利期内，药品只能由原研发厂家生产，一般情况下只有一个商品名。但专利期过后，药品仿制不受限制，几十家甚至上百家药厂均可生产同一药品，并有各自的商品名，从而导致了临床上常用的一千多种药，却有万余个商品名在使用。我国药品名称混乱已严重影响到患者安全、临床用药及医药信息的沟通，卫生部会同有关部门已决定从2007年5月1日起医院处方用药一律使用通用名。

四、别名

别名是对药品习惯上的称谓，其不受使用的约束和法律的保护。按照国家食品药品监督管理局的规定，别名从2007年1月1日起已停止使用。

第二章 抗生素

【教学要求】

- (1) 了解抗生素的发展过程;
- (2) 熟悉常用的抗生素及其特点;
- (3) 掌握抗生素的使用注意事项。

很早以前,人们就发现某些微生物对另外一些微生物的生长繁殖有抑制作用,把这种现象称为抗生。随着科学的发展,人们终于揭示出抗生现象的本质,从某些微生物体内找到了具有抗生作用的物质,并把这种物质称为抗生素,如青霉菌产生的青霉素,灰色链丝菌产生的链霉素都有明显的抗菌作用。

抗生素(Antibiotics)是由微生物(包括细菌、真菌、放线菌属)或高等动植物在生活过程中所产生的具有抗病原体或其他活性的一类次级代谢产物,能干扰其他生活细胞发育功能的化学物质。现临床常用的抗生素有微生物培养液中提取物以及用化学方法合成或半合成的化合物。

抗生素以前被称为抗菌素,事实上它不仅能杀灭细菌而且对霉菌、支原体、衣原体等其他致病微生物也有良好的抑制和杀灭作用,近年来通常将抗菌素改称为抗生素。通俗地讲,抗生素就是用于治疗各种细菌感染或抑制致病微生物感染的药物。

人类使用抗生素的历史:

1877年, Pasteur 和 Joubert 首先认识到微生物产品有可能成为治疗药物,他们发表了实验观察,即普通的微生物能抑制尿中炭疽杆菌的生长。

1928年, 弗莱明爵士发现了能杀死致命的细菌的青霉菌。青霉素治愈了梅毒和淋病,而且在当时没有任何明显的副作用。

1936年, 磺胺的临床应用开创了现代抗微生物化疗的新纪元。

1944年在新泽西大学分离出来第二种抗生素链霉素,它有效治愈了另一种可怕的传染病:结核。

1947年出现氯霉素,它主要针对痢疾、炭疽病菌,治疗轻度感染。

1948年四环素出现,这是最早的广谱抗生素。在当时看来,它能够在还未

确诊的情况下有效地使用。今天四环素基本上只被用于家畜饲养。

1956 年以来发现了万古霉素，被称为抗生素的最后武器。因为它对 G^+ 细菌细胞壁、细胞膜和 RNA 有三重杀菌机制，不易诱导细菌对其产生耐药性。

1980 年喹诺酮类药物出现。和其他抗菌药不同，它们破坏细菌染色体，不受基因交换耐药性的影响。

抗生素等抗菌剂的抑菌或杀菌作用主要有四大类作用机理：

(1) 阻碍细菌细胞壁的合成，导致细菌在低渗透压环境下膨胀破裂死亡，以这种方式作用的抗生素主要是 β -内酰胺类抗生素。哺乳动物的细胞没有细胞壁，不受这类药物的影响。

(2) 与细菌细胞膜相互作用，增强细菌细胞膜的通透性、打开膜上的离子通道，让细菌内部的有用物质漏出菌体或电解质平衡失调而死。以这种方式作用的抗生素有多粘菌素和短杆菌肽等。

(3) 与细菌核糖体或其反应底物（如 tRNA、mRNA）相互作用，抑制蛋白质的合成——这意味着细胞存活所必需的结构蛋白和酶不能被合成。以这种方式作用的抗生素包括四环素类抗生素、大环内酯类抗生素、氨基糖苷类抗生素、氯霉素等。

(4) 阻碍细菌 DNA 的复制和转录，阻碍 DNA 复制将导致细菌细胞分裂繁殖受阻，阻碍 DNA 转录成 mRNA，则导致后续的 mRNA 翻译合成蛋白的过程受阻。以这种方式作用的主要是人工合成的抗菌剂喹诺酮类（如氧氟沙星）。

抗生素的种类繁多，大体上可以分为以下十类：

(1) β -内酰胺类：青霉素类和头孢菌素类的分子结构中含有 β -内酰胺环，近年来又有较大发展，如硫酶素类、单内酰胺类， β -内酰胺酶抑制剂、甲氧青霉素类等；

(2) 氨基糖甙类包括链霉素、庆大霉素、卡那霉素、妥布霉素、丁胺卡那霉素、新霉素、核糖霉素、小诺霉素、阿斯霉素等；

(3) 四环素类包括四环素、土霉素、金霉素及强力霉素等；

(4) 氯霉素类包括氯霉素、甲砒霉素等；

(5) 大环内酯类临床常用的有红霉素、白霉素、无味红霉素、乙酰螺旋霉素、麦迪霉素、交沙霉素等；

(6) 作用于 G^+ 细菌的其他抗生素，如林可霉素、氯林可霉素、万古霉素、杆菌肽等；

(7) 作用于 G^- 菌的其他抗生素，如多粘菌素、磷霉素、卷霉素、环丝氨酸、利福平等；

(8) 抗真菌抗生素如灰黄霉素；

(9) 抗肿瘤抗生素如丝裂霉素、放线菌素 D、博莱霉素、阿霉素等；