

实用抗感染药物分类

梁 瑛 高明哲 周志锷 编著

手册

文津出版社

实用抗感染药物分类手册
SHIYONG KANG GANRANYAOWU FENLEI SHOUCHE

梁瑛 高明哲 周志鐸 编著

*

文津出版社出版
(北京北三环中路6号)

邮政编码:100011

北京出版社总发行
北京市朝阳新源印刷厂印刷

787×1092 毫米 32 开本 2.75 印张 58000 字
1996 年 8 月第 1 版 1996 年 8 月第 1 次印刷

印数 1—4000

ISBN7-80554-314-3

R·15 定价:4.50 元

序 言

穆魁津

感染性疾病,远见于上古,素视为凶险疾病。时至今日,在抗感染药物日新月异的情况下,不幸的是,在发病频率上和病情严重程度上并未减轻,较之往昔甚至有所增加,难治性感染,病情严重,病程绵长,在治疗上相当棘手。

原因是多方面的。不合理用药无疑是构成目前严峻局面的原因之一。合理用药,一方面要洞悉病情,在遴选药物、撤换药物或更换用药方法、增减用药剂量各方面,要全面考虑,既要熟悉药物的作用机制,也要了解病人的机体情况;另一方面,也要实事求是,既要反对不顾病情盲目使用贵药、新药,或盲目滥

用多种药物,也要反对不计病情而机械地恪守“规定”、“常规”,依药物的贵贱、土洋、新旧而厘定档次,为了“节约费用”,采取先用后用、逐步升级的用药方法,其结果是既贻误病情,又造成浪费,更为严重的是促使细菌获得耐药性的增加、转移、播散。

合理用药的关键在于坚持用药的针对性,一切从病情需要出发。不该使用抗生素时,坚决不用;病情严重确有需要时,也要不失时机地于一开始就使用有针对性的强有力的药物。要做到这一点,首要的问题是要了解目前众多的抗感染药物的作用机制、分类、剂型、使用方法与毒副反应。回忆我做住院医师

的时候,抗感染药物只有磺胺类一种,而现今用于抗感染的抗生素就接近百种。种类繁多,作用各异,给第一线临床医师确实带来一定的困惑和困难。

有鉴于此,北京安贞医院梁瑛、高明哲、周志鐸三位医师,在百忙中,将目前较常用的

抗感染药物分别就其作用机制、分类、剂型、剂量以及妊娠和肝、肾功能减退时选用原则汇编成册,又将药物的通用名、异名、商品名排表列出,内容简练、实用,便于携带,对临床工作者将有很大的帮助。在付梓之初,嘱作序言,不揣冒昧,略志数语并致谢忱。

目 录

抗细菌抗生素和抗菌药物的发现与发展

..... (1)

抗感染药物的作用机制..... (2)

抗感染药物分类表..... (3)

抗生素类..... (4)

青霉素类..... (4)

头孢菌素类..... (9)

碳青霉烯类..... (17)

单环 β -内酰胺类..... (19)

β -内酰胺酶抑制剂复方及

β -内酰胺类复方制剂..... (21)

氨基糖甙类..... (24)

大环内酯类..... (27)

林可霉素类..... (31)

四环素类..... (33)

氯霉素类..... (35)

利福霉素类..... (37)

抗结核药物..... (39)

多肽类..... (41)

其他抗菌药物..... (43)

合成抗菌药物..... (45)

喹诺酮类..... (45)

硝咪唑类..... (50)

磺胺类..... (52)

呋喃类	(54)	临床常见感染性疾病及其主要致病菌	(69)
抗真菌药物	(56)	与人类疾病有关的病原微生物分类 ...	(74)
抗病毒药物	(61)	主要参考文献	(81)
肝功能减退时抗菌药物的应用	(66)	后记	(82)
肾功能减退时抗菌药物的应用	(67)		
妊娠期抗菌药物的应用	(68)		

抗细菌抗生素和抗菌药物的发现与发展

1929 年, Alexander Fleming 发现青霉素。

1933 年, 磺胺药被人工合成。

1940 年, Florey & Chain 分离提纯青霉素 G 成功使其应用于临床。

40~50 年代, 多种抗生素产生菌被分离, 有临床价值的抗生素有: 链霉素、卡那霉素等氨基糖甙类、氯霉素、多粘菌素、金霉素、土霉素、红霉素、利福霉素、万古霉素。

人工合成甲硝唑。

1953 年, Newton & Abraham 发现头孢菌素 C, 对青霉素酶稳定。

1959 年, Beecham 研究组从青霉素发酵

液中分离提纯青霉素母核——6-氨基青霉素烷酸(6-APA)成功。

60 年代, 半合成青霉素迅速发展, 头孢菌素萌芽, 克林霉素被开发。

70 年代, 头孢菌素迅速发展, 酰胺类半合成青霉素被推出。 β -内酰胺酶抑制剂、克拉维酸、舒巴坦被发现, 碳青霉烯类硫霉素被分离出, 磷霉素被合成。

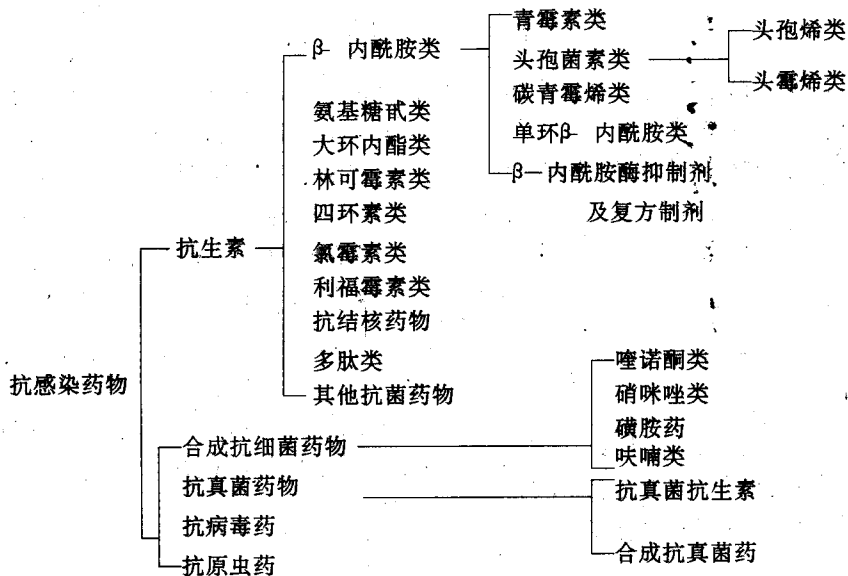
80 年代, 头孢菌素发展到第三代, 新型 β -内酰胺类出现, 喹诺酮类抗菌药崛起。

90 年代, 大环内酯类发展, 头孢菌素发展到第四代, 喹诺酮类抗菌药迅速发展。

抗感染药物作用机制

作用部位	抗感染药物
阻断细胞壁合成	β -内酰胺类:如青霉素、头孢菌素、碳青霉烯类、单环 β -内酰胺类、 β -内酰胺酶抑制剂;万古霉素、杆菌肽等;磷霉素;异烟肼
阻止核糖体蛋白合成	氨基糖甙类;四环素类;氯霉素类;大环内酯类;林可霉素;克林霉素类;氟胞嘧啶;甲硝唑、替硝唑类(抑制脱氧核糖核酸)
损伤细胞浆膜影响通透性	多粘菌素;两性霉素B;制霉菌素;咪唑类;如酮康唑、咪康唑、氟康唑等
影响叶酸代谢	磺胺类;对氨基水杨酸;乙胺丁醇
阻断DNA、RNA合成	喹诺酮类;利福平类;阿糖腺苷;新生霉素;抗病毒药

抗感染药物分类表

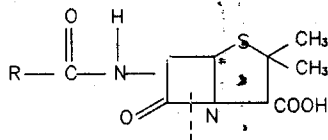


抗 生 素 类

青霉素类(Penicillins)

40年代初期,青霉素G应用于临床,主要用于抗各种G⁺球菌感染。

化学结构 母核为6-氨基青霉烷酸(6-APA)。



作用特点 随着临床的需要,青霉素的研究开发工作持续至今。目前已有耐酸,口服吸收良好的苯氧青霉素类;耐酶青霉素类(可

用于抗产青霉素酶的金葡菌感染);广谱半合成抗G⁻杆菌及抗假单胞菌的青霉素。

青霉素类抗生素杀菌活性强,全身分布好,毒性低,对敏感菌感染疗效高,价格便宜。

作用机制 干扰细菌细胞壁的合成。

主要不良反应 1. 毒性反应:如大剂量可致惊厥、抽搐;2. 过敏反应:可致过敏性休克。

注意 1. 维持有效的血药浓度;2. 溶解、稀释后的药物应在4小时内输注完毕。

作用 分类	化学 分类	代表性药物			产地	剂型 规格	成人参考剂量(日)		
		通用名	异名	商品名			口服	肌注	静滴
主要作用于 G ⁺ 菌青霉素	天然	青霉素 G Penicillin G	苄青霉素 Benzylpenicillin		中国 墨西哥	80 万 μ /支 100 万 μ /支		80~200 万 μ 分 3~4 次	200~1000 万 μ 分 2~4 次
		苄星青霉素 Benzathine penicillin	长效青霉素		西班牙	120 万 μ /支		60~120 万 μ 每月 1~2 次	
		苯氧青霉素类	青霉素 V Penicillin V		美国	0.25g/片	0.75~ 1.5g 分 3 次		
	耐酶	甲氧苄青霉素类	甲氧西林 Methicillin	新青 I	中国			4~6g 分 4 次	6~12g 分 2~4 次
		异噁唑青霉素类	苯唑西林 Oxacillin	新青 II	中国	0.5g/支		4~6g 分 4 次	4~12g 分 2~4 次

续表

作用 分类	化学 分类	代表性药物			产地	剂型 规格	成人参考剂量(日)		
		通用名	异名	商品名			口服	肌注	静滴
主要 作用 于 G ⁺ 菌 青 霉 素	耐 酶 β- 内 酰胺 类	氯唑西林 Cloxacillin	邻氯青 霉素		新加坡	0.5g/支		4~6g 分4次	4~8g 分2~4次
		氟氯西林 Flucloxacillin		氟沙星 Flucloxin	意大利 米兰	1.0g/支			2~4g 分2~4次
主要 作用 于 G ⁻ 菌 青 霉 素	β- 内 酰胺 类	美西林 Mecillinam	氮草脒 青霉素		中国	0.2g/支		1.6~2.4g 分4次	1.6~2.4g 分4次
		替莫西林 Temocillin							
广 谱 不 耐 酶 G ⁻ 菌 青 霉 素	氨基 青 霉 素 类	氨苄西林 Ampicillin	氨苄青 霉素		中国	0.5g/支		4~6g 分2次	4~12g 分2~4次
			安比西林 安比林	安必仙 安比林	香港 联邦 中国	0.25g/粒 1.5g 粉剂	1.5g 分3次		

续表

作用 分类	化学 分类	代表性药物			产地	剂型 规格	成人参考剂量(日)		
		通用名	异名	商品名			口服	肌注	静滴
抗G ⁻ 菌青霉素 广谱不耐酶	氨基青霉素类	阿莫西林 Amoxicillin	羟氨苄青霉素	阿莫仙	香港 联邦	0.25g/粒 ×24	1.5g~4g 分3次		
			阿莫西林胶囊		中美 昆明	0.25/粒 ×30	0.75~1.5g 分3次		
			羟氨苄干糖浆		英国	2.5g/ 100ml			
				弗莱莫星 Flemoxin	荷兰	0.25g/片 0.5g/片 ×30	0.5~0.75g 分2次		
		仑氨西林 Lenampicillin							
抗绿脓广谱青霉素	羧基青霉素类	羧苄西林 Carbenicillin	羧苄青霉素 卡比西林		中国	0.5g/支		4~8g 分4次	10~30g 分4次
		替卡西林 Ticarcillin	羧噻吩青霉素	替卡钠	中国 英国	1.0g/支		4~6g 分4次	12~24g 分2~4次

续表

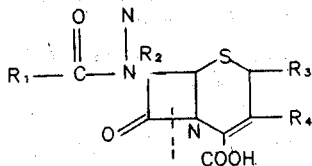
作用 分类	化学 分类	代表性药物			产地	剂型 规格	成人参考剂量(日)		
		通用名	异名	商品名			口服	肌注	静滴
抗绿脓广谱青霉素	磺基青 霉素类	磺苄西林 Sulbenicillin	磺苄青 霉素		中国	1.0g/支			
	脲基青 霉素类	哌拉西林 Piperacillin	氧哌嗪 青霉素		中国	0.5g/支 2.0g/支		4~8g 分4次	8~16g 分4次
		阿洛西林 Azlocillin						0.1g/kg 分4次	0.2~0.25g/kg 分4次
		美洛西林 Mezlocillin							0.2~0.25g/kg 分4次
		福米西林 Fomidacillin							
		匹罗西林 Piroxicillin							
	氨基酸 型	阿朴西林 Aspoxicillin							

头孢菌素类 (Cephalosporins)

头孢菌素类抗生素是一族广谱半合成抗生素。60年代发现,70年代迅速发展。现有头孢烯类、头霉素类二类。

头孢烯类

化学结构 母核为 7-氨基头孢烷酸(7-ACA)。



作用特点 根据其抗菌谱和对 G^- 杆菌抗菌活性的不同,分为四代。

一代:对 G^+ 球菌及少数 G^- 杆菌有效,对部分耐青霉素的葡萄球菌株也有效。部分品种肾毒性较大。

二代:对 G^+ 球菌及多数 G^- 杆菌有效,对 β -内酰胺酶稳定性强于一代。肾毒性较一代小,但对绿脓杆菌无效。

三代:对 G^- 杆菌具有强大活性(包括部分耐药菌株);对 β -内酰胺酶稳定,在 7- β 侧链引入羧基、磺基或进行适当酰化的品种则可抗假单胞菌属(如头孢他啶、头孢哌酮等)。对 G^+ 球菌作用同第二代头孢菌素等,对耐药金葡萄感染疗效不如第一、二代头孢菌素类。对耐甲氧西林金葡萄菌(MRSA)耐药。肾毒性低。

四代:以其特殊的作用方式,广泛的抗菌谱而优于三代头孢菌素。对 G^+ 球菌作用强于三代,对 G^- 杆菌作用类同于三代,且对多重耐药菌属、金葡萄、表皮葡萄球菌,以及肠球菌也有抗菌作用。对青霉素过敏的患者可

应用四代头孢产品,发生交叉过敏的可能性很小。

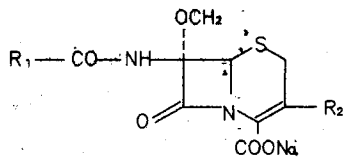
总之,头孢菌素抗菌谱广,抗菌作用强,耐青霉素酶,毒性低,过敏反应较青霉素少见,但价格昂贵。

作用机制 干扰细菌细胞壁的合成。为杀菌剂。

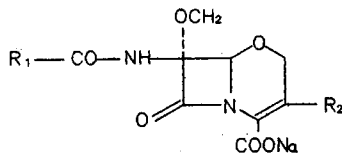
主要不良反应 除少数品种易引起凝血功能障碍外,应用三代、四代头孢菌素后出现的二重感染越来越引起临床医生的注意。

头霉烯类

化学结构



头霉烯类



氧头孢素类

头霉素自链霉菌获得的 β -内酰胺类抗生素。由于其抗需氧菌抗菌谱和抗菌活性与相应的第二代、第三代头孢菌素相类似,因此有人将头霉素类直接编入第二代、第三代头孢菌素中。

一代:抗菌作用弱,没有临床应用价值。

二代:抗菌作用类同于第二代头孢烯类,对 β -内酰胺酶高度稳定,对需氧菌、厌氧菌、 G^+ 菌、 G^- 菌皆有抗菌活性,以对脆弱拟杆菌以及对甲氧西林敏感的金葡菌活性高为特点。

三代:对厌氧菌和 G⁻ 菌作用较二代头 类厌氧杆菌所致的腹腔感染、女性生殖系感
霉素更强,对需氧菌作用与三代头孢菌素相 染疗效最为满意。注意部分药品易引起凝血
似,但对绿脓杆菌、产气杆菌无效。对因脆弱 机制障碍。

头 孢 烯 类 (针剂)

作 用 分 类	代表性药物			产 地	剂型 规格	成人参考剂量(日)	
	通用名	异 名	商 品 名			肌 注	静 滴
第一代	头孢唑林 Cefazolin	先 锋 霉 素 5 号	Cefamezin	中国山东	0.5g/支	2~4g 分 2~4 次	4g 分 2~4 次
	头孢拉定 Cefradine	先 锋 霉 素 6 号	泛捷复 Velosef A	中美上海 施贵宝	1.0g/支	2~4g 分 3~4 次	4~6g 分 2~4 次
第二代	头孢替安 Cefotiam	头 孢 噻 乙 胺 唑	泛司颇灵 Pansporin	日本	0.5g/支 1.0g/支	1~2g 分 2~4 次	4~6g 分 2~4 次
	头孢呋辛 Cefuroxime	头 孢 呋 肟	西力欣 ZINACEF	英国葛兰 素(Glaxo) 葡萄牙海 克曼	0.75g/支	2.25g 分 3 次	3~6g 分 2~4 次
			特力欣 Cefofix		0.75g/支	2.25g 分 3 次	3~6g 分 2~4 次
	头孢孟多 Cefamandole	羧 苄 四 唑 头 孢菌素	孟多力 Mandol	法国		2~4g 分 3~4 次	4~12g 分 2~4 次