



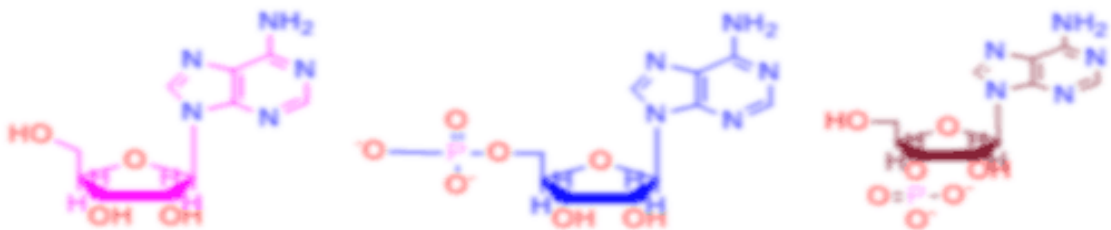
安徽中醫藥高等專科學校

# 2019 安徽省《藥物化學》精品線下開放課程

安徽中醫藥高等專科學校 | 藥學系

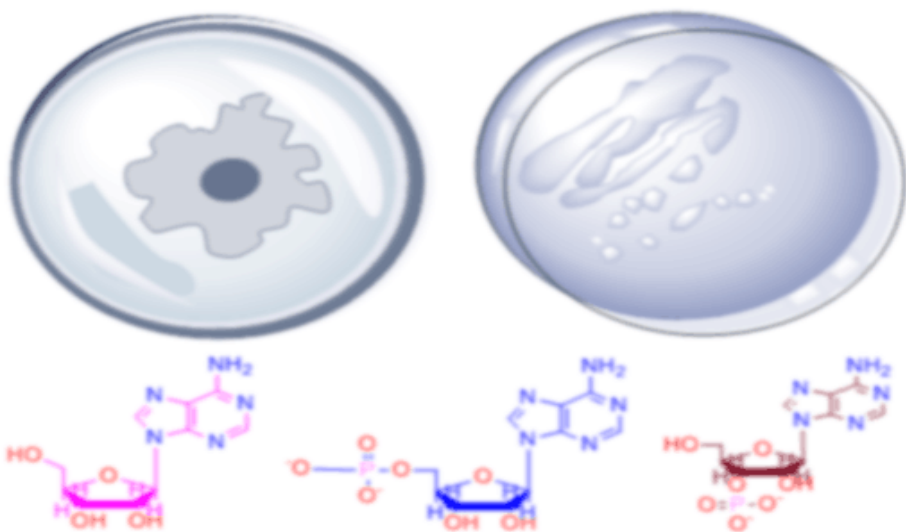
Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Department of Pharmacy

藥物化學與藥物分析教研室 | 張曉沖



## 第二章 合成抗菌药

### 第一节 磺胺类抗菌药及抗菌增效剂





## 二、磺胺类的代表药物

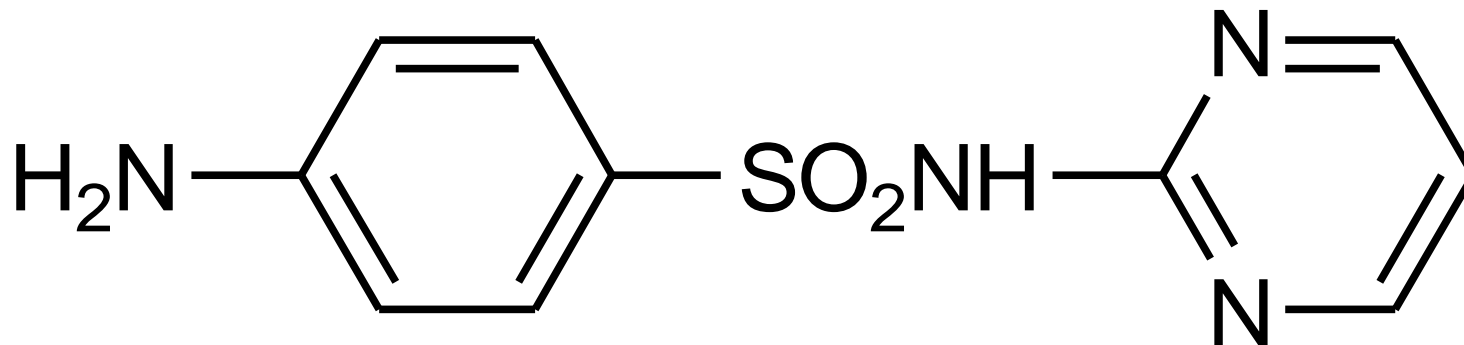
1、磺胺嘧啶（简称SD）

2、磺胺甲噁唑（简称SMZ）

## 三、抗菌增效剂



# 1、磺胺嘧啶（简称SD）



化学名：N-2-嘧啶基-4-氨基-苯磺酰胺



# 1) 理化性质

- 酸碱两性。易溶于氢氧化钠试液或氨水，可溶于稀盐酸试液，几乎不溶于水。

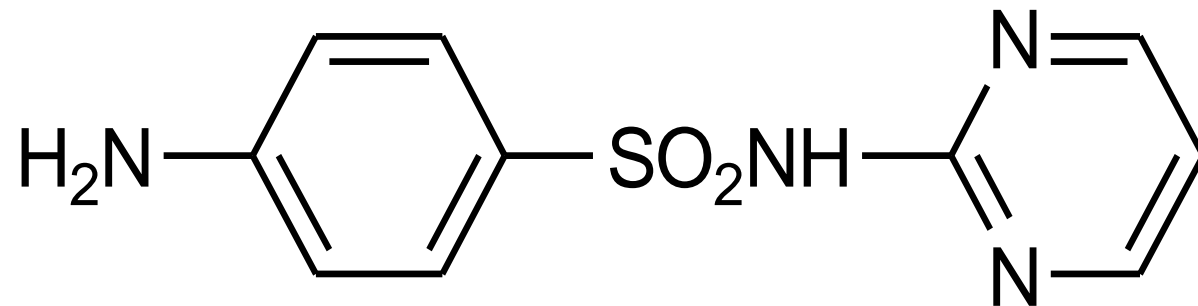
## 2) 稳定性

- 遇光会氧化变暗。
- 其钠盐水溶液，易吸收空气中的CO<sub>2</sub>而析出磺胺嘧啶↓。其钠盐注射剂也不能与酸性药物配伍使用。





### 3 ) 鉴别



- ①重氮化-偶合反应
- ②成铜盐反应进行鉴别。
- ③溶于稀盐酸+碘—碘化钾试液  
作用产生棕褐色沉淀。

## 4) 药效

- 作用强而广的抗菌药。毒副作用小。
- 是防治流脑的首选药物。

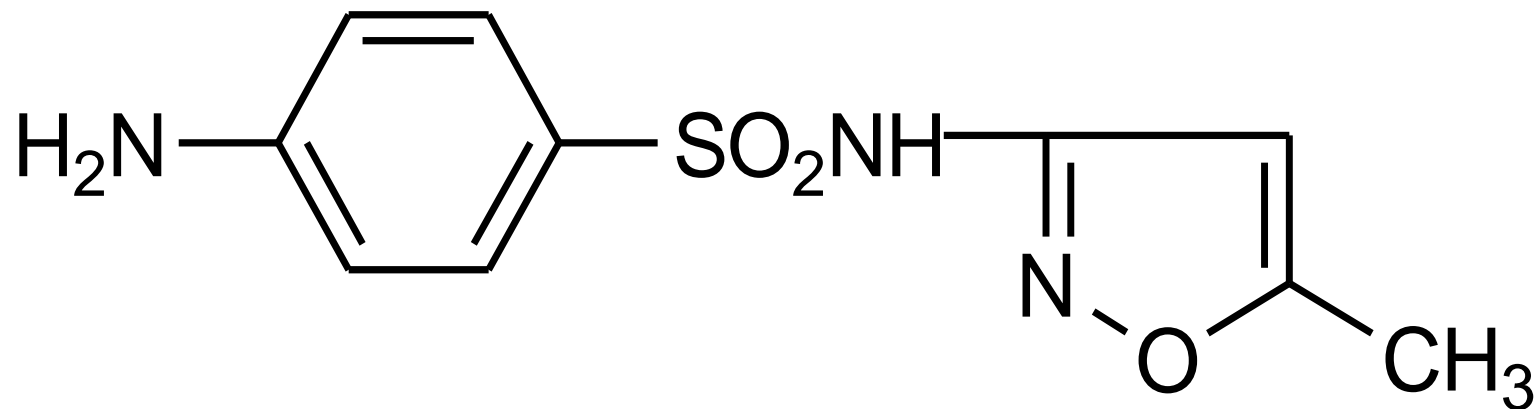


## 4) 药效



与硝酸银溶液→磺胺嘧啶银，有抗菌作用和收敛作用，临床用于治疗烧伤、烫伤创面的抗感染。

## 2、磺胺甲噁唑（简称SMZ）



化学名：*N*-（5-甲基-3-异噁唑基）-4-氨基苯磺酰胺，  
又名新诺明。



# 1) 理化性质

- 酸碱两性。易溶于氢氧化钠试液、氨水或稀盐酸试液，几乎不溶于水。

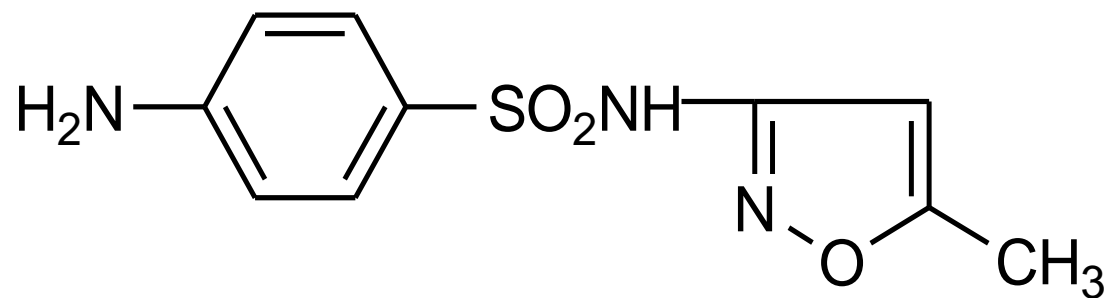


## 2) 鉴别

①重氮化--偶合反应

②铜盐反应

③与生物碱沉淀试剂反应





### 3 ) 药效

- 是长效，广谱的抗菌药。主要用于治疗尿路感染，外伤及软组织感染，呼吸道感染等。
- 思考题：服药期间为什么要多喝水？



## 如何合理应用：

- 磺胺甲恶唑在体内乙酰化率较高，乙酰化物溶解度小，易在泌尿系统析出结晶，引起血尿、闭尿等。长期服用应与小苏打同服，碱化尿液，提高代谢物的溶解度。**服药期间应注意多喝水。**

# 复方制剂的应用：

- SMZ与TMP按5:1比例配伍合用，称为**复方新诺明/复方磺胺甲噁唑**，其作用增强数十倍，是目前应用较广的磺胺类药物。



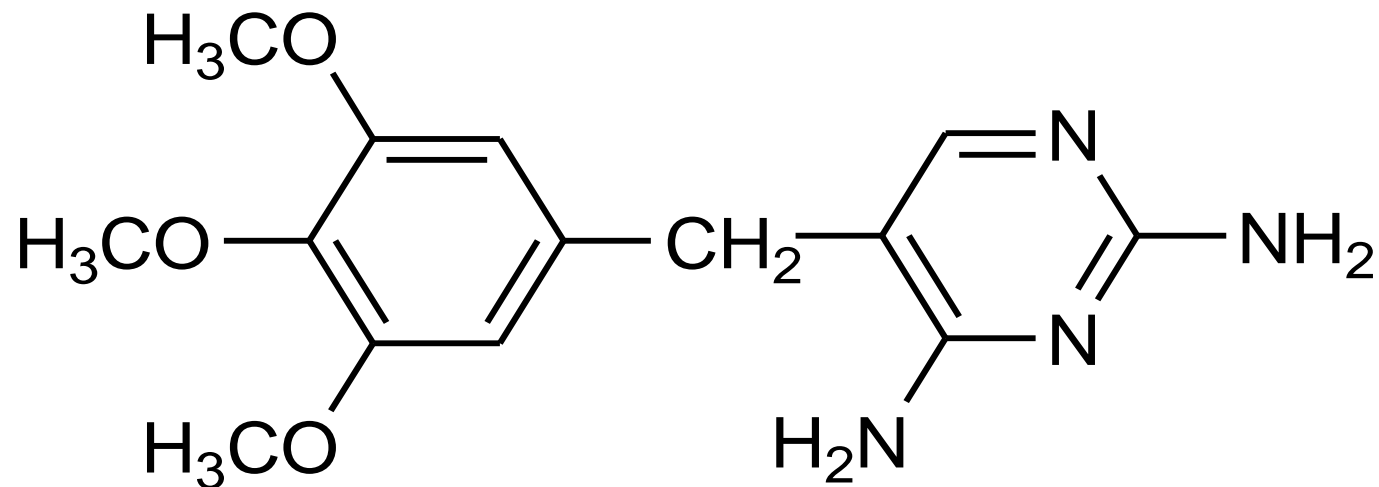


### 三、抗菌增效剂

- 抗菌增效剂是指与抗菌药配伍使用后，能增强其抗菌活性的药物。



# 甲氧苄啶（简称TMP）



化学名为2,4-二氨基-5-[(3,4,5-三甲氧基苯基)甲基]嘧啶，  
又名甲氧苄胺嘧啶。



# 1、理化性质

- 味苦，碱性，极微溶于水。较稳定。  
有芳香伯胺，易氧化，应避光密封保存。



## 2、鉴别

- 本品具含氮杂环，加入80%的乙醇中温热溶解后，与稀硫酸、碘—碘化钾试液反应生成棕褐色沉淀。



### 3、药效

- 是广谱抗菌增效剂。其抗菌谱和磺胺类药物相似，因易产生耐药性，很少单独使用，常与磺胺甲噁唑和磺胺嘧啶合用，用于治疗尿路感染，肠道感染，呼吸道感染、脑膜炎和败血症等。甲氧苄啶也可与多种药物，如与头孢氨苄、磷霉素钙等合用增强其抗菌活性。





## 小结：

- 1.掌握磺胺类药物、抗菌增效剂的基本结构和作用原理：  
磺胺类药物基本结构为对氨基苯磺酰胺，为二氢叶酸合成酶抑制剂；抗菌增效剂甲氧苄啶为二氢叶酸还原酶抑制剂，两者合用产生协同作用，抗菌作用增强。
- 2.掌握磺胺类药物共同的理化性质。
- 3.了解构效关系。



学以致用

为避免磺胺类药物对泌尿系统的损害，应采取哪些措施？

SD、SMZ在体内代谢产生的乙酰化代谢产物水溶性小，可在尿路（尤其在酸性尿中）析出结晶，引起蛋白尿、血尿、尿痛、尿少等肾损害。

- 避免长期用药，一般不超过7日。
- 嘱咐患者多饮水，每天排尿量在1200ml以上。
- 口服碳酸氢钠，简化尿液。



# 2019 安徽省《药物化学》精品线下开放课程

安徽中医药高等专科学校 | 药学系

Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Department of Pharmacy

药物化学与药物分析教研室 | 张晓冲