



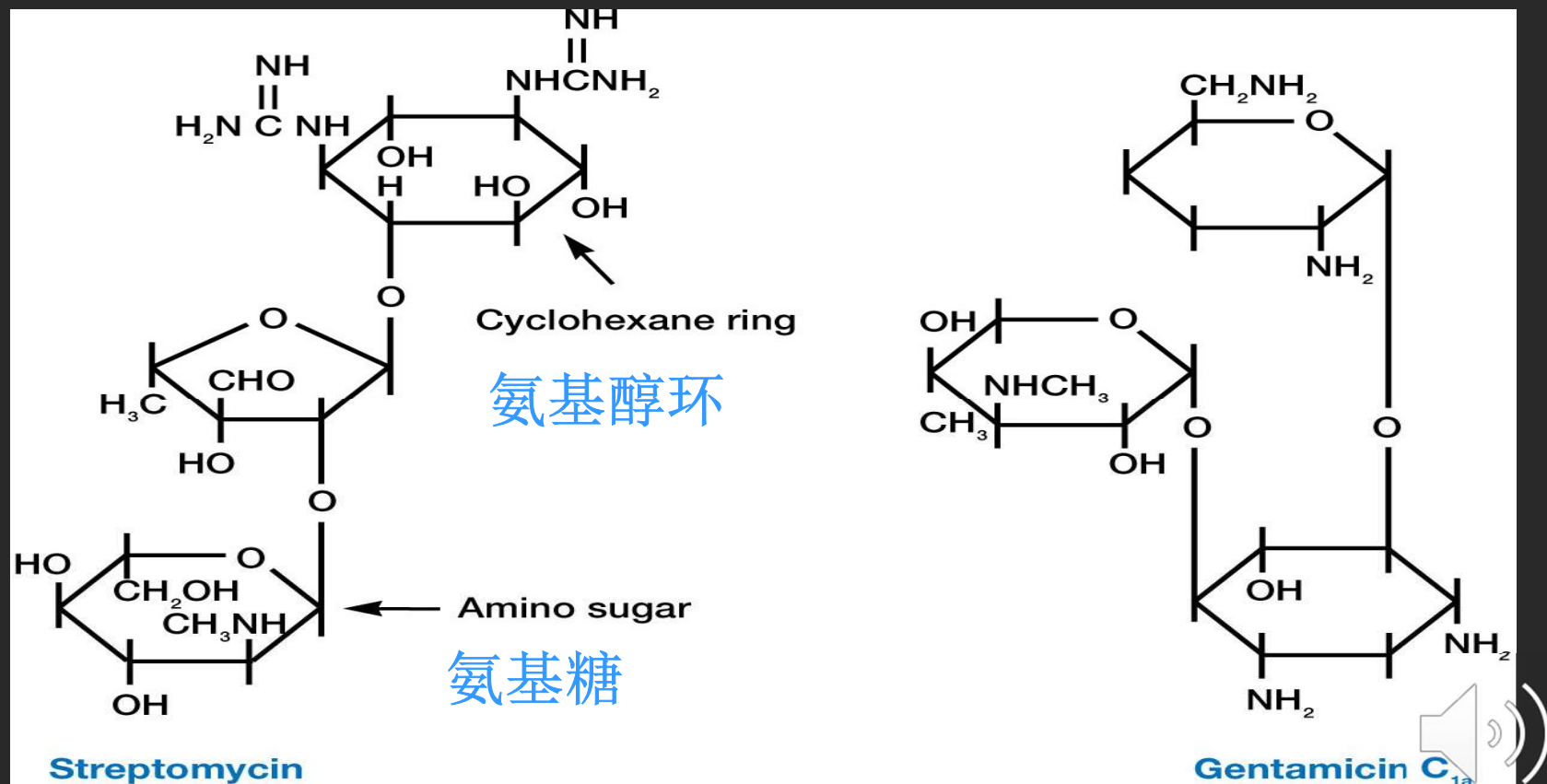
# 氨基糖苷类抗生素

amionglycosides



# 氨基糖苷类抗生素

- 化学结构：含氨基醇环和氨基糖分子



# 分类

## □ 天然来源:

链霉素 (streptomycin)

庆大霉素 (gentamicin)

卡那霉素 (kanamycin)

妥布霉素 (tobramycin)

西索米星 (sisomicin)

新霉素 (neomycin)

小诺米星 (micronomicin)

大观霉素 (spectinomycin)

## □ 半合成品:

阿米卡星 (amikacin)

奈替米星 (netilmicin)



# 抗菌作用和机制

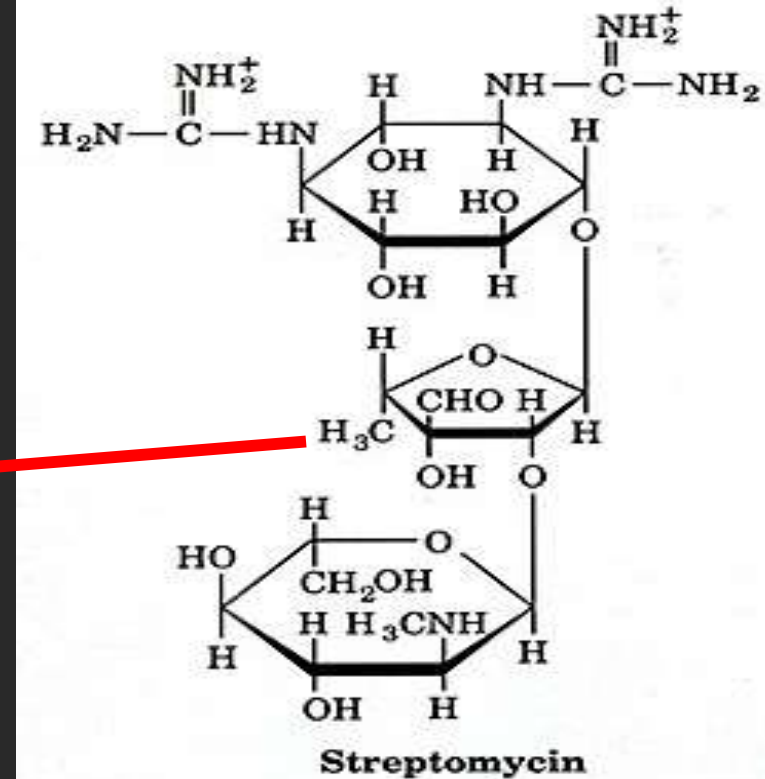
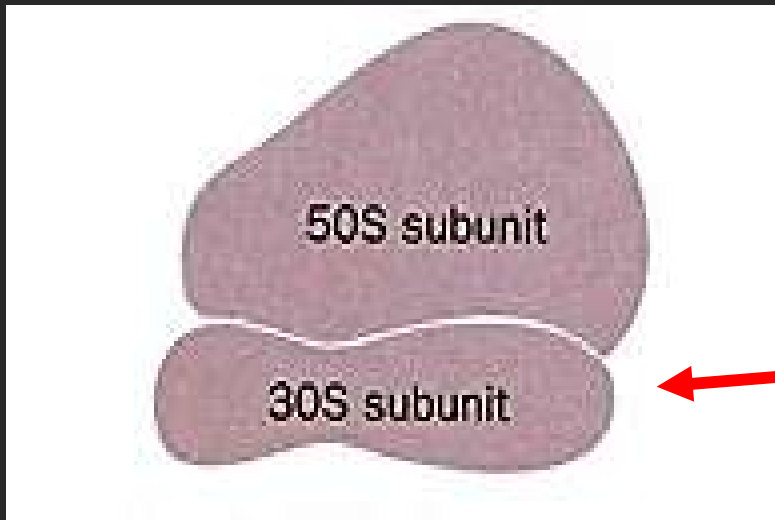
□ **抗菌谱：** 主要抗G-杆菌，为静止期杀菌药

□ **抗菌机制：**

① 多环节阻碍细菌蛋白质合成

② 破坏细菌胞浆膜的完整性

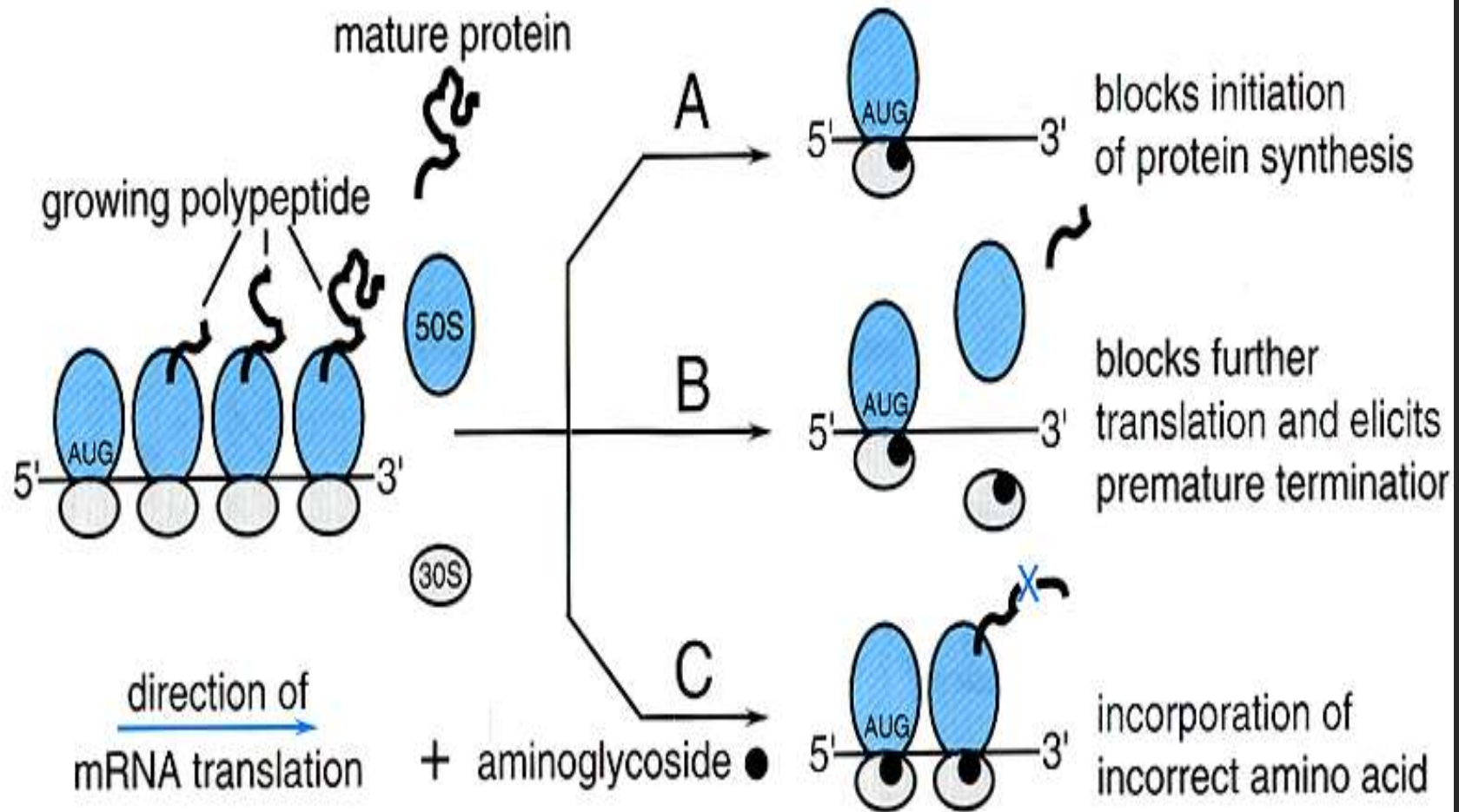




与30S亚基结合，阻止  
起始复合物的形成。

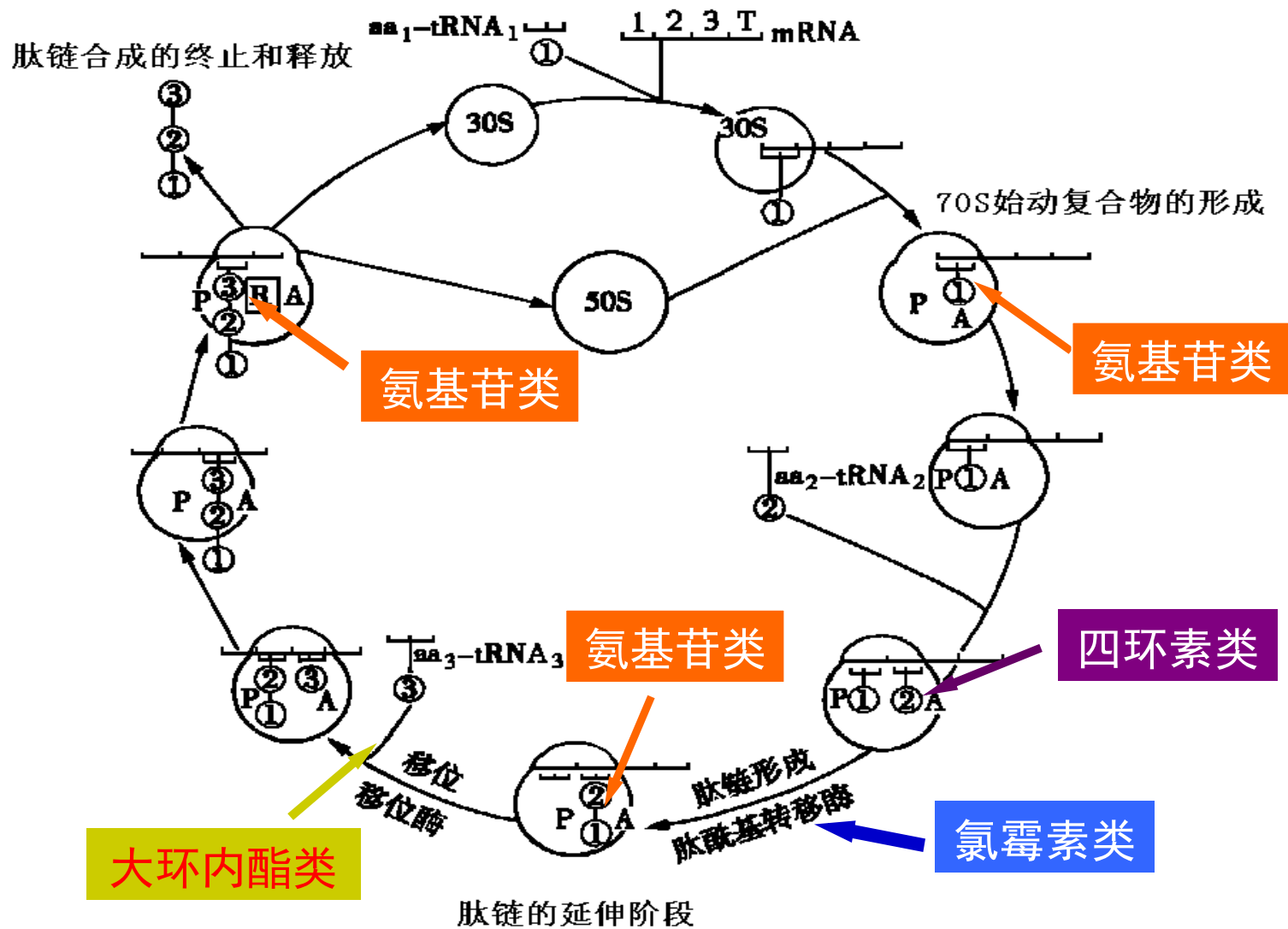
氨基糖苷类作用机制示意图（一）





氨基糖苷类作用机制示意图（二）





核蛋白体循环及有关抗生素作用部位



# 耐药机制

---

- 产生钝化酶
- 改变细胞膜通透性
- 细胞内转运功能异常
- 作用靶位改变





# 体内过程

- 1 口服**难吸收**(极性大、解离度大)
- 2 血浆蛋白结合率**低**，主要分布**细胞外液**  
**不能透过血脑屏障**
- 3 易透过胎盘屏障、易进入肾皮质、  
易进入内耳外淋巴液
- 4 体内不易代谢、不易被肾小管重吸收  
——**原形尿排**



# 不良反应

## 1 耳毒性

### □ 前庭功能损害：

表现为：眩晕、呕心、呕吐、平衡失调等  
——多见于庆大霉素和链霉素。

### □ 耳蜗功能损害：

表现为：耳鸣、听力减退，  
严重者可致耳聋  
——多见于阿米卡星和卡那霉素



## 2 肾毒性

### ——与用量疗程密切相关

- 是药物在肾皮质部蓄积及对近曲小管高亲合性所致，一般可逆。
- 易发生人群：  
老年、休克、脱水、原有肾病的患者；  
合用多粘菌素、头孢第一、二代等肾毒性药物的患者



### 3 神经肌肉阻滞作用

——骨骼肌收缩无力

一旦发生可用**新斯的明**或**葡萄糖酸钙**抢救。

### 4 过敏反应

- 可引起嗜酸性粒细胞增多、各种皮疹、药热等，甚至过敏性休克。
- 尤以**链霉素**的过敏性休克发生率高（仅次于青霉素）。



# 常用氨基苷类药物

---



# 链霉素 streptomycin

- ✧ 1944年从链霉菌培养液中分离获得；
- ✧ 第一个应用于临床的氨基糖苷类；
- ✧ 第一个治疗结核病药物；
- ✧ 常用其硫酸盐



## 【抗菌活性】

首选

- ✱ 对G-杆菌（活性低）；
- ✱ 对鼠疫、土拉菌病（有特效）；
- ✱ 结核杆菌（有效，包括脓腔和干酪化脓腔）
- ✱ 溶血性链球菌、草绿色链球菌及肠球菌引起的心内膜炎（联合青霉素）



# 【不良反应】

❄ 最易引起过敏反应；

❄ 耳毒性常见；

❄ 其次为神经肌肉麻痹；

❄ 肾毒性发生率较低。





# 庆大霉素 gentamicin

✧ 从小单胞菌的培养液中分离获得

## 【抗菌特点】

首选

✧ 各种 **G-杆菌** 尤其沙雷菌属感染；

✧ **铜绿假单胞菌** 所致严重感染  
(联合羧苄西林)；

✧ **G<sup>+</sup>**：肠球菌、葡萄球菌或草绿色链球菌所致  
严重感染（联合青霉素或其它抗生素）



# 【不良反应】

---

✱ 耳毒性

✱ 肾毒性

✱ 神经肌肉阻滞

✱ 过敏反应（偶见）



# 卡那霉素 (kanamycin)

✱ 从链霉菌培养液中分离获得

## 【抗菌特点】

- ✱ 常见G-菌； 结核杆菌；
- ✱ 不良反应多，疗效不突出，现已被庆大霉素、妥布霉素等取代；
- ✱ 仅用于抗结核病的第二线药。



# 妥布霉素 (tobramycin)

✦ 从链霉菌培养液中分离获得，也可由卡那霉素B脱氧获得。

## 【抗菌特点】

- ✦ 抗肺炎杆菌、肠杆菌属、变形杆菌属等G-杆菌包括铜绿假单胞菌 > 庆大霉素
- ✦ 但抗其它G-杆菌 < 庆大霉素
- ✦ 葡萄球菌有效
- ✦ 对耐庆大霉素菌株有效



# 阿米卡星（**amikacin**, 丁胺卡那霉素）

✧ 是卡那霉素的半合成衍生物

## 【抗菌特点】

✧ 氨基糖苷类抗生素中**抗菌谱最广**的抗生素

✧ **抗菌作用 < 庆大霉素**

✧ 优点：对肠道**G-杆菌**和铜绿假单胞菌所产生的**多种钝化酶稳定**

✧ 常用于对其它氨基糖苷类**耐药菌感染**

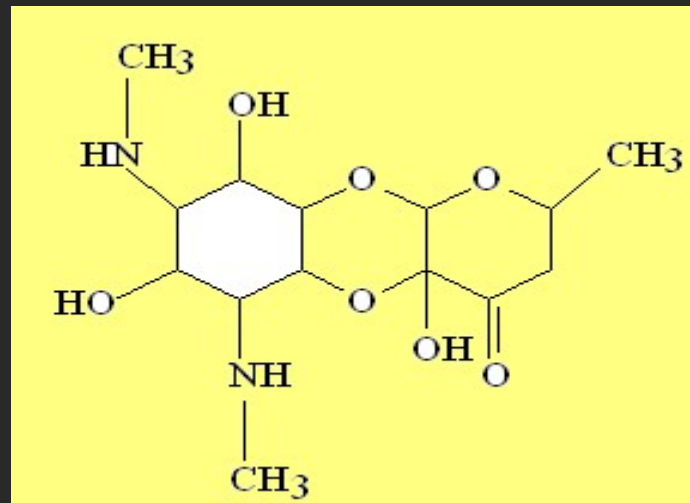
首选



# 氨基醇类

## 大观霉素

- ✦ 由链霉菌产生的一种氨基醇类抗生素。
- ✦ 主要用于对淋病奈氏菌的感染。



# 多粘菌素类

## 多粘菌素B、 粘菌素

- ✦ 从多粘杆菌、粘杆菌培养液中提得。
- ✦ 抗菌机制：阳离子表面活性剂。与细菌细胞膜外脂质双分子层结合，使细胞膜通透性增加，胞内物质外泄，致细菌死亡。
- ✦ 局部应用：对革兰氏阴性菌有效。尤其对铜绿假单孢菌有效。



谢谢！

