1. 抗生素类抗菌药
2. β-内酰胺类抗菌药物

单环β-内酰胺类

β-内酰胺 是由四个原子组成，环的张力比较大，使其化 学性质不稳定，易发生开环导致失活。

1. 青霉素类
2. 青霉素类

青霉素类药物的母核结构中有3个手性碳原子，其立体构型为2S，5R，6R。其母核的2位存在羧基，可以与碱金属离子成盐，可制成碱金属盐供注射用；6位上存在氨基，可与不同羧酸形成酰胺，酰胺基团的变化可影响青霉素类药物的抗菌谱。

1. 青霉素

通常是指青霉素也被称为苄青霉素，是第一个在临床使用的抗生素。

含有四元的β-内酰胺环与四氢噻唑环骈合的结构，具有较大的分子张力。在酸性或碱性条件 下，均可以使青霉素的β-内酰胺环发生裂解， 生成青霉酸、青霉醛和青霉胺。

【适应证】（1)用于敏感细菌所致各种感 染，如脓肿、菌血症、肺炎和心内膜炎等。

(2)青霉素为以下感染的首选药：①溶血性链 球菌感染，如咽炎、扁桃体猩红热、丹毒、蜂窝织炎和产褥热等；②肺炎链球菌感染如肺 炎、中耳炎、脑膜炎和菌血症等；③不产青霉素酶葡萄球菌感染；④炭疽；：⑤破伤风、气性坏疽等梭状芽孢杆菌感染；⑥梅毒（包括先天 性梅毒）；⑦钩端螺旋体病；⑧回归热；⑨白 喉；⑩青霉素与氨基糖苷类药物联合用于治疗 草绿色链球菌心内膜炎。（3)青霉素亦可用于 治疗：①流行性脑脊髓膜炎；②放线菌病；③淋 病；④奋森咽峡炎；⑤莱姆病；⑥多杀巴斯德 菌感染；⑦鼠咬热；⑧李斯特菌感染；⑨除脆 弱拟杆菌以外的许多厌氧菌感染；⑩风湿性心 脏病或先天性心脏病患者进行口腔、胃肠道或 泌尿生殖道手术和操作前，可用于预防感染性 心内膜炎发生。

【注意事项〗（1)对一种青霉素过敏者可 能对其他青霉素类药、青霉胺过敏，有哮喘、 湿疹、枯草热、荨麻疹等过敏性疾病患者慎用。

1. 非奈西林

将青霉素6位侧链改为具有吸电子作用的苯氧乙 酰氨基得到耐酸的非奈西林。

1. 苯唑西林

以含有3-苯基-5-甲基异噁唑结构侧链引人青霉素6位得到苯唑西林。

1. 氨苄西林

将青霉素6位酰胺侧链引入苯甘氨酸，得到氨苄西林。

【适应证〗用于敏感菌所致的呼吸道感染、 胃肠道感染、尿路感染、软组织感染、心内膜炎、脑膜炎、败血症等。

【注意事项〗（1)传染性单核细胞增多症、 巨细胞病毒感染、淋巴细胞白血病、淋巴瘤患 者应用本品时易发生皮疹，宜避免使用。（2)本 品须新鲜配制。氨苄西林钠溶液浓度愈高，稳 定性愈差。在5°C时1%氨苄西林钠溶液能保持 其生物效价7天，但5%的溶液则为24h。浓度 为30mg/ml的氨苄西林钠静脉滴注液在室温放 置2 ~8h仍能至少保持其90%的效价，放置冰 箱内则可保持其90%的效价至72h。稳定性可 因葡萄糖、果糖和乳酸的存在而降低，亦随温 度升高而降低。（3)妊娠及哺乳期妇女用药见 青霉素有关项下。

1. 阿莫西林

将氨苄西林结构中苯甘氨酸的苯环4 位引入羟基得到阿莫西林。

【适应证〗用于敏感菌（不产β-内酰胺酶 菌株）所致的下列感染：（1)溶血性链球菌、 肺炎链球菌、葡萄球菌或流感嗜血杆菌所致中 耳炎、鼻窦炎、咽炎、扁桃体炎等上呼吸道感 染。（2)大肠埃希菌、奇异变形杆菌或粪肠球 菌所致的泌尿生殖道感染。（3)溶血性链球 菌、葡萄球菌或大肠埃希菌所致的皮肤软组织 感染。（4)溶血性链球菌、肺炎链球菌、葡萄 球菌或流感嗜血杆菌所致急性支气管炎、肺炎等 下呼吸道感染。（5)急性单纯性淋病。（6)伤 寒、伤寒带菌者及钩端螺旋体病。（7)与克拉 霉素、质子栗抑制剂联合口服用药根除胃、十 二指肠幽门螺杆菌，降低消化道溃疡复发率。

〖注意事项〗（1)传染性单核细胞增多症 患者应用本品易发生皮瘆，应避免使用。⑵疗 程较长患者应检查肝、肾功能和血常规。(3)哮 喘、湿疹、枯草热、荨麻疹等过敏性疾病史者 慎用；老年人和肾功能严重损害时可能须调整 剂量。（4)动物生殖试验显示，10倍于人类剂 量的阿莫西林未损害大鼠和小鼠的生育力和胎 儿。但在人类尚缺乏足够的对照研究，鉴于动 物生殖试验不能完全预测人体反应，妊娠期妇 女仅在确有必要时应用本品。由于乳汁中可分 泌少量阿莫西林，乳母服用后可致婴儿过敏。 (5)类似其他广谱抗生素5有可能发生由白色 念珠菌等非敏感微生物引起的二重感染，尤其 是慢性病患者和自身免疫功能失调者。

1. 哌拉西林

在氨苄西林侧链的氨基上引入极性较大的哌嗪酮酸基团得到哌拉西林。

【适应证〗用于：（1)敏感肠杆菌科细菌、 铜绿假单胞菌、不动杆菌属所致的败血症、上尿路及复杂性尿路感染、呼吸道感染、胆道感 染、腹腔感染、盆腔感染以及皮肤、软组织感 染等。（2)与氨基糖苷类联合可用于有粒细胞 减少症免疫缺陷患者的感染。

【注意事项〗（1)哌拉西林在少数患者尤 其是肾功能不全者可致出血，发生后应及时停 药并予适当治疗；肾功能不全者应适当减量。 (2)有过敏史、出血史、溃疡性结肠炎、克隆 病或抗生素相关肠炎者慎用。（3)哌拉西林不 可加入碳酸氢钠溶液中静滴。（4)妊娠期妇女 仅在确有必要时使用本品。本品可少量由乳汁 中分泌，哺乳期妇女用药时宜暂停哺乳。

1. 美洛西林

在氨苄西林侧链的氨基上引入极性较大的咪唑啉酮酸基团得到美洛西林。

1. 头孢菌素类

头孢菌素的基本母核为(3-内酰胺环与氢化 噻嗪环骈合得到，为至关重要抗菌活性药效团， 在青霉素分子中(3-内酰胺环氮原子上的孤对电 子不能与P-内酰胺环的羰基共轭，因此，化学 稳定性较差。在头孢菌素分子中P-内酰胺环氮 原子上的孤对电子可以与氢化噻嗪环中的双键 形成共轭，使P-内酰胺环趋于稳定。所以多数 的头孢菌素类抗生素均具有耐酸的性质。与青 霉素母核的“四元环并五元环”稠环体系相 比，头孢菌素为“四元环并六元环”稠环体 系，所以P -内酰胺环分子内张力较小，稳定性 高于青霉素。

1. 头孢氨苄

可口服的半合成头孢菌素药物。

【适应证】用于金黄色葡萄球菌、溶血性链 球菌、肺炎球菌、大肠埃希菌、肺炎杆菌、流 感杆菌、痢疾杆菌等敏感菌株所致的轻、中度 感染。包括：（1)扁桃体炎、扁桃体周炎、咽 喉炎、支气管炎、肺炎、支气管肺炎、哮喘和 支气管扩张感染以及手术后胸腔感染。（2)急 性及慢性肾盂肾炎、膀胱炎、前列腺炎及泌尿生殖系统感染。（3)中耳炎、外耳炎、鼻窦 炎。（4)上颌骨周炎、上颌骨骨膜炎、上颌骨 骨髓炎、牙槽脓肿、根尖性牙周炎、智齿周围 炎、拔牙后感染。（5)睑腺炎、眼睑炎、急性 泪囊炎。（6)毛囊炎、疖、丹毒、蜂窝织炎、 脓疱、痈、痤疮感染、皮下脓肿、创伤感染、 乳腺炎、淋巴管炎等。

【注意事项〗（1)有胃肠道疾病史者，尤 其有溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗菌药物相 关性结肠炎者以及肾功能不全者慎用。头孢菌 素很少产生抗生素相关性腹泻。（2)当日剂量超 过％时，应考虑改用注射用头孢菌素类药。头孢氨节主要经肾脏排出，肾功能不全者须 酌减剂量。（4)头孢氨苄可透过胎盘屏障，并可 由乳汁分泌，妊励甫乳期妇女须权衡利弊后应用。

1. 头孢羟氨苄

可口服的半合成头孢菌素药物。

1. 头孢唑林

将头孢氨苄C3位甲基上连有5-甲基-2-巯基-1，3, 4-噻二唑的杂环，同时在C7位的氨基上连有四氮唑乙酰基得到头孢唑林。

【适应证】用于敏感细菌所致的中耳炎、支气管炎、肺炎等呼吸道感染、尿路感染、皮肤软组织感染、骨和关节感染、败血症、感染性 心内膜炎、肝胆系统感染，以及眼、耳鼻喉科等感染；用于外科围术期预防感染。

【注意事项〗（1)对青霉素过敏或过敏体 质者慎用。（2)对肾功能不全者应调整剂量，以免出现脑病、肌察挛、癫痫等神经系统反应。 (3)患有胃肠道疾病史者，特别是溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗生素相关性结肠炎和肾功能不全者慎用。（4)头孢唑林与庆大霉素或其他肾毒性抗生素合用有增加肾损害的危险性；因头孢唑林部分在肝脏代谢，肝功能不全者应慎用。 (5)静脉滴注时将本品用注射用水、氯化钠注射液溶解后使用，当静脉滴注体积超过l00ml 时不要用注射用水。（6)配制后的药液应避光保存。室温保存时间不得超过48h。（7)在常温不溶解时，可微热至37T使其溶解。（8)头 孢菌素可由乳汁分泌，哺乳期妇女应用须权衡利弊后决定。（9)早产儿及1个月以下的新生 儿不推存应用本品。（10)头孢唑林在老年人中血浆消除半衰期较年轻人明显延长，应按肾功能酌减剂量或延长给药间期。

1. 头孢克洛

头孢氨苄的C3位甲基以卤素替代得到的可口服的半合成头孢菌素头孢克洛。

【适应证〗用于敏感菌株所致的感染：（1)中 耳炎：由肺炎双球菌、流感嗜血杆菌、葡萄球 菌、化脓性链球菌（A组p -溶血性链球菌） 和卡他莫拉菌引起。（2)下呼吸道感染（包括肺炎）：由肺炎双球菌、流感嗜血杆菌、化脓 性链球菌（A组p-溶血性链球菌）和卡他莫拉菌引起。（3)上呼吸道感染（包括咽炎和扁 桃体炎）：由化脓性链球菌（A组p-溶血性链球菌）和卡他莫拉菌引起。（4)尿道感染（包 括肾盂肾炎和膀胱炎）：由大肠埃希菌、奇异变形杆菌、克雷伯杆菌属和凝固酶阴性的葡萄 球菌引起。（5)皮肤和皮肤组织感染：由金黄色葡萄球菌和化脓性链球菌（A组(3 -溶血性 链球菌）引起。（6)鼻窦炎。（7)淋球菌性尿道炎：应进行适当的组织培养和敏感性研究， 以测定致病菌对头孢克洛的敏感性。

【注意事项〗（1)长期应用的患者应仔细 观察，如发生二重感染5必须采取适当措施。

(2)严重肾功能不全者慎用，因本品在无尿症 患者体内的半衰期为2.3〜2.8h。对中度、严 重肾功能不全者，应进行仔细的临床和实验室 监测。（3)对于有胃肠道病史（特别是结肠炎）的患者、使用抗生素（包括头孢菌素）要 慎重。（4)使用过程中若发生腹泻，应考虑到 会产生抗生素相关性腹泻，对轻微者停药即可, 中度至严重病例，应采取适当治疗。（5)除非急 需，妊娠期妇女不宜使用。（6)哺乳期妇女单 剂量500mg顿服，在母乳中可测出少量的头孢 克洛，故哺乳妇女慎用。

1. 头孢呋辛

头孢呋辛的C7位的氨基上连有顺式的甲氧肟基酰基侧链，该甲氧肟基对P-内酰胺酶有高度的稳定作用，因此，头孢呋辛对酶较稳定，C3位为氨基甲酸酿，改变药动学性质。

【适应证〗用于敏惑细菌所致的感染：（1)呼吸道感染：由肺炎链球菌、流感嗜血杆菌（含氨节西林耐药菌）、克雷伯杆菌属、金黄色葡 萄球菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）、化脓性链球菌及大肠埃希菌所引起的呼 吸道感染，如中耳炎、鼻窦炎、扁桃体炎、咽炎和急、慢性支气管炎、支气管扩张合并感染、细菌性肺炎、肺脓肿和术后肺部感染。（2)泌尿道感染：由大肠埃希菌及克雷伯杆菌属细菌所致的尿道感染，如肾盂肾炎、膀胱炎和无症状性菌尿症。（3)皮肤及软组织感染：由金黄色葡萄球菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）、化脓性链球菌、大肠埃希菌、克雷伯杆菌属及肠道杆菌属细菌所致的皮肤及软组织感染，如蜂窝织炎、丹毒、腹膜炎及创伤感染。(4)败血症：由金黄色葡萄球菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）、肺炎链球菌大肠 埃希菌、流感嗜血杆菌（含氨苄西林耐药菌）及克雷伯杆菌属细菌所引起的败血症。（5)脑 膜炎：由肺炎链球菌、流感嗜血杆菌（含氨苄西林耐药菌）、脑膜炎奈瑟菌及金黄色葡萄球菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）所引起的脑膜炎。（6)淋病：由淋病奈瑟菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）所引起的单纯性（无合并症）及有合并症的淋病，尤其适用于不宜用青霉素治疗者。（7)骨及关节感染：由金黄色葡萄球菌（青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌）所引起的骨及关节感染。 (8)可用于术前或术中防止敏感致病菌的生 长，减少术中及术后因污染引起的感染。如腹部骨盆及矫形外科手术、心脏、肺部、食管及血管手术、全关节置换手术中的预防感染。

【注意事项〗（1)使用时应注意监测肾功 能，特别是对接受高剂量的重症患者。（2)肾 功能不全者应减少一日剂量。（3)头孢呋辛能 引起抗生素相关性腹泻，应警惕。抗生素相关 性腹泻诊断确立后，应给予适宜的治疗。轻度 者停药即可，中、重度者应给予液体、电解质、蛋白质补充，并需选用对梭状芽孢杆菌有效的 抗菌药物治疗。（4)有报道少数患儿使用本品 时出现轻、中度听力受损。（5)相容性和稳定 性：①肌内注射：用注射用水配制时，在室温 24h,冷处5°C保存48h可保持活性。超过此期 限，任何未用的溶液均应丢弃。②静脉注射: 用注射用水配制时，〇.75g、1.5g本品配制后 的溶液在室温24h5冰箱5°C保存48h可保持活 性。③在室温下与以下一些溶液可以24h内保持 相容性，肝素（l0~50U/ml)，氯化钾（10 ~ 40mEq/L),碳酸氢钠，0.9%氯化钠。④0.75g 和1.5g本品，用50ml或100ml 5%葡萄糖注射 液、0.9%氯化钠注射液、0.45%氯化钠注射液稀 释，可以在室温存放24h,冰箱存放7日。（6)妊 娠期妇女应权衡利弊。本品能在乳汁分泌，哺 乳期妇女慎用。（7)有报道新生儿对头孢菌素 有蓄积作用，对3个月以下儿童的安全有效性 尚未确定，因而不推荐使用。

1. 头孢呋辛酯

将头孢呋辛分子中的羧基与乙酰氧基-1-醇成酿得到头孢呋辛酯，提高了脂溶性，成为可以口服的药物。

1. 头孢哌酮

头孢哌酮为在C-3位甲基上引人硫代甲基四氮唑杂环取代乙酰氧基，可提高其抗菌性并显示良好的药动学性质，在血中浓度较高。

1. 头孢曲松

头孢曲松的C3位上引入酸性较强的杂环，6-羟基-1，2, 4-三嗪-5-酮，产生独特的非线性的剂量依赖性药动学性质。头孢曲松以钠盐的形式注射给药，可广泛分布全身组织和体液，可以通过脑膜，在脑脊液中达到治疗浓度。

【适应证I用于敏感致病菌所致的：⑴脓毒 血症、脑膜炎，播散性莱姆病（早、晚期）和腹 部感染（腹膜炎、胆道及胃肠道感染）。（2)骨、 关节、软组织、皮肤及伤口感染。（3)免疫功能 减退者感染。(4)肾脏及泌尿道感染。(5)呼吸 道感染，尤其是肺炎、耳鼻喉感染。（6)生殖 系统感染，包括淋病。（7)围术期预防感染。

【注意事项〗（1)本品不得用于高胆红素 血症的新生儿和早产儿的治疗。体外研究显示 头孢曲松可从血清蛋白结合部位取代胆红素， 从而引起这些患者的胆红素脑病。（2)有胃肠 道疾病史者，特别是溃疡性结肠炎、局限性肠 炎或抗生素相关性结肠炎者慎用。（3)由于头 孢菌素类毒性低，所以有慢性肝病患者应用时 不需调整剂量。患者有严重肾损害或肝硬化 者应调整剂量。（4)肾功能不全患者肌酐清除 率多5ml/min，一日应用剂量少于2g时，不需 作剂量调整。血液透析清除的量不多，透析后无需增补剂量。（5)头孢曲松与氨苯蝶啶、万 古霉素、氟康唑以及氨基糖苷类抗生蒙具有不 相容性。（6)头孢曲松的保存温度不宜超过 20°C。（7)头孢曲松溶液可在室温下保持其理 化稳定性6h;在2°C〜8°C条件下保持24h。

(8)与含钙剂注射液（葡萄糖酸钙、氯化钙、 复方氯化钠注射液、乳酸钠林格注射液、复方 乳酸钠葡萄糖注射液）直接混合，其结构中具 有羧酸钠和酰胺钠等阴离子基团，极易与钙离 子形成不溶性沉淀，发生头孢曲松钙白色细微 浑浊或沉淀，阻塞毛细血管，在组织中沉积并 形成肉芽肿5增加发生胆、肾、心、肺结石的 危险性，严禁与含钙注射液混合（尤其儿童)。

(9)妊娠及哺乳期妇应用须权衡利弊。（10)新 生儿（体重<2kg者）的用药安全尚未确定。 有黄疸的新生儿或有黄疽严重倾向的新生儿应 慎用或避免使用。

1. 头孢匹罗

第四代头孢菌素。

1. 头孢吡肟

第四代头孢菌素。

【适应证〗用于对头孢吡肟敏感的需氧革兰 阴性菌中的肠杆菌包括阴沟肠杆菌、产气肠杆 菌、肺炎克雷伯杆菌、沙雷菌、大肠埃希菌、 铜绿假单胞杆菌、奇异变形杆菌、普通变形杆 菌、聚团肠杆菌属、柠檬酸杆菌、不动杆菌属、 嗜血流感杆菌（包括产P-内酰胺酶株）、沙门 菌属、摩氏摩根菌、志贺菌属、淋球菌，革兰 阳性球菌包括肺炎链球菌（包括耐青霉素菌）、 溶血性链球菌、化脓性链球菌、无乳链球菌、 草绿色链球菌等链球菌属细菌、甲氧西林敏感 金黄色葡萄球菌、甲氧西林敏感表皮葡萄球菌 等葡萄球菌，以及厌氧菌中的类杆菌（包括产 黑色素类杆菌和其他经口感染的类杆菌）、产气 荚膜梭状菌、梭状菌、动弯杆菌属菌，消化链球 菌和丙酸杆菌所致的中、重度感染。（1)下呼吸 道感染（肺炎和支气管炎）；（2)单纯性下尿 路感染和复杂性尿路感染（包括肾盂肾炎）；

(3)非复杂性皮肤和皮肤软组织感染；（4)复 杂性腹腔内感染（包括腹膜炎和胆道感染）；

(5)妇产科感染；（6)败血症；（7)中性粒细 胞减少伴发热患者的经验治疗；（8)儿童细菌 性脑脊髓膜炎。

【注意事项】（1)本品可诱发抗生素相关 性腹泻。（2)有胃肠道疾患，尤其是肠炎患者 慎用。（3)可能会引起凝血酶原活性下降。如 肝、肾功能不全，营养不良以及延长抗菌治疗 的患者应监测凝血酶原时间。必要时给予外源 性维生素K。（4)本品所含精氨酸在所用剂量为最大推荐剂量的33倍时会引起葡萄糖代谢紊 乱和一过性血钾升高。较低剂量时精氨酸的影 响尚不明确。（5)对肾功能不全者，用量应根 据肾功能调整。（6)与氨基糖苷类药或强效利 尿剂合用时，应加强临床观察，并监测肾功能， 避免引发肾毒性或耳毒性。用于肾功能不全患者 时应注意调整剂量，以免出现脑病、肌痉挛、癫 痫等神经系统反应。（7)妊娠期妇女慎用。头孢 吡肟在乳汁有极少量排出（浓度约0.5ug/ml），哺乳期妇女慎用。（8)老年患者肾功能正常时 使用一般推荐剂量；肾功能不全老年患者，使 用时应根据肾功能调整。

1. 其他类
2. 克拉维酸

克拉维酸是由内酰胺环和氢化异囉唑环骈合而成，张力比青霉素要大得多，因此易接受β-内酰胺酶中亲核基团，如羟基、氨基的进攻，进行不可逆的烷化，使P-内酰胺酶彻底失活。典型的氧青霉烷类药物。

1. 舒巴坦

具有青霉烷酸的基本结构，但分子结构中的硫被氧化成砜，为不可逆竞争性P-内酰胺酶抑制剂。舒巴坦是此类结构药物的代表，为广谱的、不可逆竞争性P-内酰胺酶抑制剂。

1. 舒它西林

将氨苄西林与舒巴坦以 1 : 1的形式以次甲基相连形成双酯结构的前 体药物，称为舒他西林。

1. 他唑巴坦

②他唑巴坦是在舒巴坦结构中甲基上氢被1，2, 3-三氮唑取代得到的衍生物，为青霉烷砜另一个不可逆P-内酰胺酶抑制剂，其抑酶谱的广度和活性都强于克拉维酸和舒巴坦。

1. 亚胺培南

亚胺培南对大多数β-内酰胺酶高度稳定， 对脆弱杆菌、铜绿假单胞菌有高效。

1. 美罗培南

美罗培南为4位上带有甲基的广谱碳青霉烯类抗生素，对肾脱氢肽酶稳定，使用时不需并用酶抑制剂。并对许多需氧菌和厌氧菌有很强的杀菌作用，其作用达到甚至超过第三代头孢菌素类。

【适应证〗用于由单一或多种敏感细菌引起的成人及儿童的下列感染：（1)肺炎（院内获得性肺炎）。（2)尿路感染。（3)腹腔内感染。 (4)妇科感染（例如子宫内膜炎)。（5)皮肤及软组织感染。（6)脑膜炎。（7)败血症。

〖注意事项〗（1)美罗培南与其他碳青霉 烯类和P-内酰胺类抗生素、青霉素和头孢菌素局部交叉过敏反应。（2)对严重肾功能障碍 的患者，需根据其肌酐清除率调节用量；在严重肝功能障碍的患者，有可能加重肝功能障碍。

进食不良或全身状况不良的患者，有可能引起维生素K缺乏症状。（4)有癫痫史或中枢神经系统功能障碍的患者，发生痉挛、意识障碍等中枢神经系统症状的可能性增加。（5)有时会出现肝脏氨基转移酶AST及ALT升高，连续给药1周以上或有肝脏疾病的患者，应进行肝功能检查。（6)尚未确立本品在妊娠期给药的安全性，当判判断利大于弊时，才可用于妊娠期或有可能妊娠的妇女。给药期间应避免哺乳。（7）用于老年人时，因可能存在生理功能下降 或维生素K缺乏而应慎重

1. 法罗培南
2. 氨曲南

氨曲南是全合成单环β-内酰胺抗生素。

[适应证〗用于治疗敏感需氧革兰阴性菌所致的感染，如尿路感染、下呼吸道感染、败血症、腹腔内感染、妇科感染、术后伤口及烧伤、溃疡等皮肤软组织感染等。亦用于治疗医院内感染中的上述类型感染（如免疫缺陷患者的医 院内感染）。

【注意事项〗（1)氨曲南与青霉素之间无 交叉过敏反应，但对青霉素、头孢菌素过敏及 过敏体质者仍需慎用。（2)氨曲南肝毒性低， 但对肝功能不全者应观察其动态变化。（3)氨 曲南与萘夫西林、头孢拉定、甲硝唑有配伍禁 忌。（4)氨曲南可引起不同程度的抗生素相关 性腹泻。（5)氨曲南可透过胎盘屏障进入胎儿 循环，虽动物实验显示其对胎儿无影响、无毒 性和无致畸作用，但缺乏在妊娠妇女中进行的 充分良好对照的临床研究，对妊娠妇女或有妊娠 可能性的妇女，仅在必要时方可给药。（6)氨曲 南可由乳汁分泌，浓度不及母体血浆药物浓度 的1%，哺乳妇女使用时应暂停哺乳。（7)婴幼儿慎用。（8)老年人用药剂量应按其肾功能 减退情况酌情减量。

b.氨基糖苷类抗菌药物

氨基糖苷类抗生素是由氨基糖（单糖或双糖）与氨基醇形成的苷。由于含有氨基和其他 碱性基团。这类抗生素都呈碱性，通常在临床都. 被制成结晶性硫酸盐或盐酸盐。

1. 卡那霉素A

卡那霉素有三个组分，A、B、C,临床使 用的是以A组分为主的硫酸盐（98%)。卡那霉素为广谱抗生素，卡那霉素分子含有内特定的羟基或氨基，是制备半合成氨基糖苷类抗生素的基础。

1. 阿米卡星

阿米卡星是在卡那霉素分子 的链霉胺部分引入氨基羟丁酰基侧链得到的半 合成抗生素。

【适应证〗用于：（1)铜绿假单胞菌及部 分其他假单胞菌、大肠埃希菌、变形杆菌属、 克雷伯菌属、肠杆菌属、沙雷菌属、不动杆菌 属等敏感革兰阴性杆菌与葡萄球菌属（甲氧西 林敏感株)所致严重感染，如菌血症或败血 症、细菌性心内膜炎、下呼吸道感染、骨关节 感染、胆道感染、腹腔感染、复杂性尿路感染、 皮肤软组织感染等。（2)对卡那霉素、庆大霉 素或妥布霉素耐药菌株所致的严重感染。

【注意事项〗（1)氨基糖苷类与P -内酰胺 类（头孢菌素类与青霉素类）混合时可致相互 失活，与上述抗生素联合应用时须分瓶滴注。 阿米卡星亦不宜与其他药物同瓶滴注。

1. 妥布霉素
2. 奈替米星
3. 依替米星

【适应证〗适用于对其敏感的大肠埃希菌、 克雷伯肺炎杆菌、枸橼酸杆菌、肠杆菌属、流 感嗜血杆菌、铜绿假单胞菌、葡萄球菌、沙雷 杆菌属、不动杆菌属、变形杆菌属等引起的各 种感染。临床研究显示本品对以下感染有较好 的疗效：（1)呼吸道感染：如急性支气管炎、 慢性支气管炎急性发作、社区肺部感染等。

(2)肾脏和泌尿生殖系统感染：如急性肾盂肾 炎、膀胱炎、慢性肾盂肾炎或慢性膀胱炎急性 发作等。（3)皮肤软组织和其他感染：如皮肤 及软组织感染、外伤、创伤和手术产后的感染 及其他敏感菌感染。

【注意事项〗（1)在使用本品治疗过程中 应密切观察肾功能和第1[对脑神经功能的变化， 并尽可能进行血浆药物浓度监测，尤其是已明 确或怀疑有肾功能减退或衰竭患者、大面积烧 伤患者、新生儿、早产儿、婴幼儿和老年患者， 休克、心力衰竭、腹水、严重脱水患者及肾功 能在短期内有较大波动者。（2)本品可能发生 神经肌肉阻滞现象，因此对接受麻醉剂、琥珀 胆碱、筒箭毒碱或大量输人枸橼酸抗凝剂的血 液患者应特别注意，一旦出现神经肌肉阻滞现 象应停用本品，静脉内给予钙盐进行治疗。

(3)妊娠期妇女使用前须充分权衡利弊。哺乳 期妇女在用药期间需暂停哺乳。（4)儿童慎用。（5)老年患者由于生理性肾功能减退，应注意调整用法与用量。

1. 庆大霉素C
2. 庆大霉素C
3. 庆大霉素C

c.大环内酯类抗菌药物

1. 红霉素

红霉素是由红色链丝菌 产生的抗生素，包括红霉素A、B和C。红霉素通常即指红霉素A，其 他两个组分B和C则被视为杂质。红霉素水溶 性较小，只能口服，但在酸中不稳定，易被胃 酸破坏。为了增加其在水中的溶解性，用红霉 素与乳糖醛酸成盐，得到的盐可供注射使用。

【适应证〗用于：（1)作为青霉素过敏患 者治疗下列感染的替代用药：溶血性链球菌、 肺炎链球菌等所致的急性扁桃体炎、急性咽炎、 鼻窦炎；溶血性链球菌所致的猩红热、蜂窝织 炎；白喉及白喉带菌者；气性坏疽、炭疽、破 伤风；放线菌病；梅毒；李斯特菌病等。（2)军 团菌病。（3)肺炎支原体肺炎。（4)肺炎衣原体 肺炎。（5)其他衣原体属、支原体属所致泌尿 生殖系感染。（6)沙眼衣原体结膜炎。（7)淋 球菌感染。（8)厌氧菌所致口腔感染。（9)空 肠弯曲菌肠炎。（10)百日咳。

【注意事项〗（1)溶血性链球菌感染用本 品治疗时，至少需持续10日，以防止急性风湿 热的发生。（2)肾功能不全者一般无需减少用 量。（3)用药期间定期监测肝功能。肝病患者 和严重肾功能损害者红霉素的剂量应适当减少。

患者对一种红霉素制剂过敏或不能耐受时，对其他红霉素制剂也可过敏或不能耐受。

因不同细菌对红霉素的敏感性存在一定差 异，故应做药敏测定。（6)可透过胎盘屏障而 进入胎儿循环，浓度一般不高，文献中也无对胎儿影响方面的报道，妊娠期妇女应用时仍宜 权衡利弊。（7)红霉素有相当量进入母乳中，哺乳期妇女应用时应暂停哺乳。

1. 琥乙红霉素

可使红霉素苦味消失的號乙红霉素，到体内水解后释放出红霉素。

【适应证】（1)本品可作为青霉素过敏患 者治疗下列感染的替代用药：溶血性链球菌、 肺炎链球菌等所致的急性扁桃体炎、急性咽炎、 鼻窦炎；溶血性链球菌所致猩红热、蜂窝织炎； 白喉及白喉带菌者；气性坏疽、炭疽、破伤风； 放线菌病；梅毒；李斯特菌病等。（2)军团菌 病。（3)肺炎支原体肺炎。（4)肺炎衣原体肺 炎。（5)衣原体属、支原体属所致泌尿生殖系 统感染。（6)沙眼衣原体结膜炎。（7)厌氧菌 所致的口腔感染。（8)空肠弯曲菌肠炎。（9)百 日咳。（1)风湿热复发、感染性心内膜炎 (风湿性心脏病、先天性心脏病、心脏瓣膜置 换术后）及口腔、上呼吸道医疗操作时的预防 用药（青霉素的替代用药）。

【注意事项〗（1)溶血性链球菌感染因用 本品治疗时，至少需持续10日，以防止急性风 湿热的发生。（2)肾功能不全者一般无需减少 剂量，但严重肾功能损害者的剂量应适当减少。

用药期间定期检查肝功能。患者对一种红 霉素制剂过敏或不能耐受时，对其他红霉素制 剂也可能过敏或不能耐受。（4)因不同细菌对 红霉素的敏感性存在一定差异，故应做药敏测 定。（5)因肝毒性可能增加，妊娠期妇女禁 用。（6)由于有相当量由乳汁分泌，哺乳期妇 女慎用或暂停哺乳。

1. 克拉霉素

克拉霉素是对红霉素C- 6羟基甲基化后得到衍生物。

【适应证〗用于敏感菌所致感染：（l)鼻 咽感染：扁桃体炎、咽炎、鼻窦炎。（2)下呼 吸道感染：急性支气管炎、慢性支气管炎急性 发作和肺炎。（3)皮肤软组织感染：脓疱病、 丹毒、毛囊疖和伤口感染。（4)急性中耳 炎、肺炎支原体肺炎、沙眼衣原体引起的尿道 炎及宫颈炎等。（5)与其他药物联合用于鸟分 枝杆菌感染、幽门螺杆菌感染的治疗。

【注意事项】（1)中度、严重肝肾功能不 全者慎用。（2)肾功能严重损害（肌酐清除率 <30ml/min)者，须作剂量调整：一次0. 25g， 一日1次；重症感染者首剂〇.5g,以后一次 0.25g, —日2次。（3)与红霉素及其他大环内 酯类药之间有交叉过敏和交叉耐药性。（4)可 能出现真菌或耐药细菌导致的严重感染。（5)可 空腹口服，也可与食物或牛奶同服，与食物同 服不影响其吸收。（6)血液或腹膜透析不能降 低克拉霉素的血浆药物浓度。（7) 6月龄以下小儿的疗效和安全性尚未确定。（8)妊娠及哺乳期妇女禁用。

1. 罗红霉素

罗红霉素是将红霉素C- 9的羰基进行修饰，可以阻止C-6羟基与C-9 羰基的缩合。

【适应证】用于敏感菌株所致的感染：

(1) 上、下呼吸道感染。（2)耳鼻喉感染。

(3)生殖器感染（淋球菌感染除外）。（4)皮 肤软组织感染。（5)支原体肺炎、沙眼衣原体 感染及军团病等。

【注意事项〗（1)肝功能不全者慎用。严 重肝硬化者的半衰期延长至正常水平2倍以上， 如确实需要使用，则一次〇.15g, —日1次。

(2)轻度肾功能不全者不需作剂量调整，严重 肾功能不全者给药时间延长1倍（一次0. 15g， 一日1次）。（3)本品与红霉素存在交叉耐药 性。（4)进食后服药可减少吸收，与牛奶同服 可增加吸收。（5)妊娠及哺乳期妇女慎用。低 于0.05%的给药量由乳汁分泌，哺乳期妇女需 考虑是否中止授乳。

5.阿奇霉素

阿奇霉素为将红霉素肟经贝克曼重排后得到扩环产物，再经还原、甲基化等反应，将氮原子引入到大环内酯骨架中制 得第一个环内含氮的15元环大环内酯抗生素。

【适应证〗用于：（1)化脓性链球菌引起 的急性咽炎、急性扁桃体炎。（2)敏感细菌引起的鼻窦炎、中耳炎、急性支气管炎、慢性支 气管炎急性发作。（3)肺炎链球菌、流感嗜血杆菌以及肺炎支原体所致的肺炎。（4)沙眼衣 原体及非多种耐药淋病奈瑟菌所致的尿道炎和宫颈炎。（5)敏感细菌引起的皮肤软组织 感染。

【注意事项〗（1)轻度肾功能不全者（肌 酐清除率多40ml/min)不需作剂量调整，但阿 奇霉素对较严重肾功能不全患者中的使用尚无 资料，给这些患者使用阿奇霉素时应慎重。(2)肝功能不全者慎用5产重肝病患者不应使用，用药期间定期随访肝功能。（3)用药期间如果发生过敏反应（如血管神经性水肿、皮肤反应、史蒂文斯-约翰综合征及中毒性表皮坏 死等），应即停药，并采取适当措施。（4)静 脉滴注宜慢，一次静脉滴注时间不得少于 60min，滴注液浓度不得高于2. Omg/ml，同时监测心电图。（5)治疗盆腔炎时若怀疑合并厌 氧菌感染，应合用抗厌氧菌药。（6)进食可影响阿奇霉素的吸收，口服用药需在餐前lh或餐 后2h服用。（7)妊娠及哺乳期妇女慎用。

(8)治疗小于6月龄儿童中耳炎、社区获得性 肺炎及小于2岁儿童咽炎或扁桃体炎的疗效与 安全性尚未确定。

d.四环素类抗菌药物

1. 土霉素
2. 金霉素
3. 四环素

在四环素类抗生素结构中都含有酸性的酚 羟基和烯醇羟基及碱性的二甲胺基。

【适应证〗用于：（1)立克次体病，包括 流行性斑瘆伤寒、地方性斑瘆伤寒、落基山热、 恙虫病和Q热。（2)支原体属感染。（3)回归 热、布鲁菌病、霍乱、兔热病及鼠疫。治疗布 鲁菌病和鼠疫时需与氨基糖苷类联合应用。

【注意事项〗（1)对一种四环素类药过敏 者可对其他四环素类药呈现过敏。（2)长期用 药期间应定期监测血常规及肾功能。（3)原有 肝病者和肾功能不全者不宜应用，如确有指征 应用时须慎重考虑，并调整剂量。（4)治疗性 病时，如怀疑同时合并螺旋体感染，用药前须 行暗视野显微镜检查及血清学检查，后者每月 1次，至少4次。（5)长时间静脉给药有发生 血栓性静脉炎的可能，故应尽早改为口服序贯 治疗。（6)四环素可透过胎盘屏障进入胎儿体 内，沉积在牙齿和骨的钙质区内，引起胎儿牙 齿变色，并在动物中有致畸胎作用。妊娠期妇 女对四环素肝毒性反应尤为敏感，因此妊娠期 妇女避免使用。如确有指征应用本品时，一日 滴注剂量以lg为宜，不应超过lg，血浆药物浓 度应保持在15ug/ml以下。（7)四环素可由乳 汁分泌，哺乳期妇女应用期间应暂停授乳。 (幻老年患者常伴有肾功能不全，需调整剂量。

1. 多西环素

多西环素是土霉素 在6位的羟基被除去得到，稳定性有较大的提高。

【适应证〗用于：（1)立克次体病，如流 行性斑瘆伤寒、地方性斑疹伤寒、落基山热、 恙虫病和Q热。（2)支原体属感染。（3)衣原体属感染，包括鹦鹉热、性病、淋巴肉芽肿、 非特异性尿道炎、输卵管炎、宫颈炎及沙眼。

(4)回归热、布鲁菌病、霍乱、兔热病、鼠 疫、软下疳。治疗布鲁菌病和鼠疫时需与氨基 糖苷类联合应用。（5)对青霉素类过敏患者的 破伤风、气性坏疽、雅司、梅毒、淋病和钩端螺\_旋体病以及放线菌属、李斯特菌感染。（6)中、 重度寻常痤疮者作为辅助治疗。

【注意事项〗（1)应用本品时可能发生耐 药菌的过度繁殖。一旦发生二重感染，即停用 本品并予以相应治疗。（2)治疗性病时，如怀 疑同时合并梅毒螺旋体感染，用药前须行暗视 野显微镜检查及血清学检查，后者每月1次， 至少4次。（3)长期用药时应定期监测血常规 以及肝功能。（4)肾功能减退者不必调整剂 量，应用时通常亦不引起血尿素氮的升高。

(5)多西环素可与食品、牛奶或含碳酸盐饮料 同服。

1. 美他环素

美他环素为土霉素6位甲 基与6位羟基脱水衍生物，因除去了其不稳定的轻基，而稳定性较好。

1. 米诺环素

米诺环素 为四环素脱去6位甲基和6位羟基，同时在7 位引入二甲氨基得到的衍生物，由于脱去6位 羟基，盐酸米诺环素对酸很稳定，不会发生脱水和重排形成内酯环的产物。

【适应证〗用于对本品敏感的葡萄球菌、链 球菌、肺炎球菌、淋病奈瑟菌、痢疾杆菌、大 肠埃希菌、克雷伯菌、变形杆菌、绿脓杆菌、 梅毒螺旋体及衣原体等所致的感染：（1)败血 症、菌血症。（2)浅表性化脓性感染：毛囊炎、脓皮症、扁桃体炎、肩周炎、泪囊炎、牙 龈炎、夕卜阴炎、创伤感染、疖、疖肿症、痤疮、 手术后感染等。（3)深部化脓性疾病：乳腺 炎、淋巴管（结）炎、颌下腺炎、骨髓炎、骨 炎。（4)急慢性支气管炎、喘息型支气管炎、 支气管扩张、支气管肺炎、细菌性肺炎、异型 肺炎、肺部化脓症。（5)痢疾、肠炎、感染性 食物中毒、胆管炎、胆囊炎。（6)腹膜炎。

(7)肾盂肾炎、肾盂炎、肾盂膀胱炎、尿道 炎、膀胱炎、前列腺炎、附睾炎、宫内感染、 淋病、男性非淋菌性尿道炎。（8)中耳炎、副 鼻窦炎、颌下腺炎。（9)梅毒。

【注意事项】（1)肝、肾功能不全者、食 管通过障碍者、老年人、口服吸收不良或不能 进食者及全身状态恶化患者（因易引发维生素 K缺乏症）慎用。（2)由于具有前庭神经毒 性，本品已不作为脑膜炎奈瑟菌带菌者和脑膜 炎奈瑟菌感染的治疗药。（3)对米诺环素过敏 者有可能对其他四环素类也过敏^ (4)由于可 致头晕、倦怠等，驾驶员、从事危险性较大的 机器操作及高空作业者应避免服用。（5)米诺 环素滞留于食管并崩解时，会引起食管溃疡, 故应多饮水，尤其临睡前服用时。（6)严重肾 功能不全者的剂量应低于常用剂量，如需长期 治疗，应监测血浆药物浓度。（7)用药期间应 定期检查肝、肾功能。（8)较易引起光敏性皮 炎，故用药后应避免日晒。

1. 合成抗菌药
2. 喹诺酮类抗菌药

喹诺酮类抗菌药是一类具有1，4-二氢- 4-氧代喹啉（或氮杂喹啉）-3-羧酸结构的化合物。

1. 诺氟沙星

诺氟沙星是第一个在喹诺酮分子引人氟原 子的药物，其6位引入的氟原子增加喹诺酮药物与靶酶DNA促旋酶作用和增加进人细菌细胞 的通透性，因而使得抗菌活性增加。

【适应证〗用于敏感菌所引起的呼吸道、泌 尿道、胃肠道感染，如急性支气管炎、慢性支 气管炎急性发作、肺炎、膀胱炎、伤寒和急、 慢性肾盂肾炎等。

【注意事项〗（1)不宜静脉注射，如需静 脉滴注，静滴速度不宜过t夬，宜控制在lh以 上。（2)大肠埃希菌对诺氟沙星耐药者多见， 应在给药前留取尿培养标本，参考细菌药敏结 果调整用药。（3)大剂量应用或尿PH在7.0 以上时可发生结晶尿。宜多进水，保持24h排尿量在1200ml以上。肾功能不全者，根据肾功 能调整剂量。（4)严重肝功能不全或肝、肾功 能均不全者，其血浆药物浓度增高，故均需权 衡利弊后应用，并调整剂量。（5)老年患者常 有肾功能减退，因本品\_分经肾排出，需减量 应用。（6)极个别缺乏葡萄糖-6-磷酸脱氢 酶的患者可能发生溶血反应。

1. 环丙沙星

诺氟沙星分子中1位乙基被环丙基取代得 到环丙沙星。

【适应证〗用于敏感菌感染所致：（1)泌尿生殖系统感染，包括单纯性、复杂性尿路感 染、细菌性前列腺炎、淋病奈瑟菌尿道炎或宫颈炎（包括产酶株所致者）。（2)呼吸道感染，包括敏感革兰阴性杆菌所致支气管感染急性发作及肺部感染。（3)胃肠道感染，由志贺菌属、沙门菌属、产肠毒素大肠埃希菌、亲水气单胞菌、副溶血弧菌等所致。(4)伤寒。(5)骨和关节感染。（6)皮肤软组织感染。（7)败血 症等全身感染。

【注意事项〗宜空腹服用，食物虽可延迟其 吸收，但其总吸收量（生物利用度）未见减 少，故也可于餐后服用，以减少胃肠道反应； 服用时宜同时饮水250ml。

1. 左氧氟沙星

将喹诺酮1位和8位成环得到左氧氟沙星。

【适应证】用于敏感细菌感染所致的中、重 度感染：（1)呼吸系统感染：包括敏感革兰阴 性杆菌所致急性支气管炎、慢性支气管炎急性 发作、弥漫性支气管炎、支气管扩张合并感 染、肺炎、扁桃体炎（扁桃体周围脓肿）。

1. 泌尿系统感染：肾盂肾炎、复杂性尿路 感染等。（3)生殖系统感染：急性前列腺炎、急 性附睾炎、宫腔感染、子宫附件炎、盆腔炎（疑 有厌氧菌感染时可合用甲硝唑)、淋病奈瑟菌尿道 炎或宫颈炎（包括产酶株所致者)。（4)皮肤软 组织感染：传染性脓疱病、蜂窝织炎、淋巴管 (结）炎、皮下脓肿、肛脓肿等。（5)肠道感 染：细菌性痢疾、感染性肠炎、沙门菌属肠炎、 伤寒及副伤寒。（6)败血症、粒细胞减少及免 疫功能低下患者的各种感染。（7)其他感染: 乳腺炎、外伤、烧伤及手术后伤口感染、腹腔 感染（必要时合用甲硝唑）、胆囊炎、胆管炎、 骨与关节感染以及五官科感染等。

【注意事项〗（1)静脉滴注时间为每l00ml 至少60min。本品不宜与其他药物同瓶混合或 在同一根静脉输液管内静滴。（2)肾功能不全 者按肌酐清除率应减量或延长给药间隔时间： 20~49ml/min者，首剂0. 4g，以后每24h给予0.2g。

1. 洛美沙星

在喹诺酮类药物的6位和8位同时引入两个氟原子并在7位引人3-甲基哌嗪得到洛美沙星。

1. 依诺沙星

在喹诺酮类抗菌药物母核的8位以氮取代时，使生物利用度提高，其代表药物是依诺沙星

1. 司帕沙星

喹诺酮类抗菌药物母核的5位以氨基取代时，增加3位羧基和4位羰基的电子云密度，使其与DNA促旋酶和拓扑异构酶IV作用加强，因而活性较强，代表药物是司帕沙星。

1. 加替沙星

在喹诺酮类抗菌药物母核的8位以8-甲氧基取代时，其光毒性较小。代表药物为加替沙星。

1. 莫西沙星

莫西沙星是具有广谱抗菌活性的8-甲氧基喹诺酮类抗菌药。

【适应证〗用于上呼吸道和下呼吸道感染， 如急性窦炎、慢性支气管急性发作、社区获得 性炎及皮肤和软组织感染。

【注意事项】（1)可延长一些患者心电图 Q-T间期。其Q-T间期延长的程度随着药物 浓度的增加而增加。①应避免用于Q-T间期 延长的患者、患有无法纠正的低钾血症及接受 la类（如奎宁丁、普鲁卡因）或瓜类（如胺 碘酮、索托洛尔）抗心律失常药者。②慎与可 能延长Q-T间期的药物（西沙必利、红霉素、 抗精神病药和三环类抗抑郁药）合用。③慎用 于有致心律失常的因素存在时（如严重的心动 过缓或急性心肌缺血(2)可能出现假膜性 肠炎。（3)治疗复杂盆腔感染患者（如伴有输 卵管-卵巢或盆腔脓肿）时，需考虑经静脉给 药进行治疗，不推荐口服。

1. 磺胺类抗菌药物

基本结构为对氨基苯磺酰胺

1. 对氨基苯磺酰胺

磺胺类抗菌药物的基本结构是对氨基磺酰胺。

1. 磺胺甲恶唑

磺胺甲恶唑，又名新 诺明。

适应证〗用于敏感细菌及其他敏感病原微 生物所致：（1)急性单纯性尿路感染。⑵与甲 氧苄陡合用可治疗对其敏感的流感嗜血杆菌、肺炎链球菌和其他链球菌所致的中耳炎。(3)星形 奴卡菌病。（4)对氯喹耐药的恶性疟疾治疗的 辅助用药。（5)与乙胺嘧啶联合用药治疗鼠弓 形虫引起的弓形虫病。（6)治疗沙眼衣原体所 致宫颈炎，尿道炎和新生儿包涵体结膜炎的次 选药。（7)治疗杜克雷嗜血杆菌所致软下疳的 次选药。（8)敏感脑膜炎奈瑟菌所致的流行性 脑脊髓膜炎流行时的预防。

【注意事项〗（1)交叉过敏反应。对一种 磺胺药呈现过敏者对其他磺胺药也可能过敏。

本品可致肝损害，发生黄疸、肝功能减 退，严重者可发生急性肝坏死。故有肝功能损 害患者宜避免全身应用。（3)如应用本品疗程 长，剂量大宜同服碳酸氢钠并多饮水，以防止 不良反应。失水、休克和老年患者应用本品易 致肾损害，应慎用或避免应用本品。肾功能减 退患者不宜应用本品。（4)下列情况应慎用： 缺乏G-6-PD、血卟啉症患者。（5)治疗中 须注意检查：①血象，对接受较长疗程的患者 尤为重要。②定期尿液检查。③肝、肾功能。

1. 磺胺嘧啶

磺胺嘧啶的特点是进入脑脊液的浓度超过血药浓度一半可达到治疗浓度。

【适应证〗用于敏感细菌及其他敏感病原微 生物所致的感染：（1)脑膜炎球菌所致的流行 性脑脊髓膜炎的治疗和预防。（2)与甲氧苄啶 合用治疗对其敏感的流感嗜血杆菌、肺炎链球 菌和其他链球菌所致的中耳炎、皮肤软组织感 染、急性支气管炎和肺部感染。（3)星形奴卡 菌病。（4)对氯喹耐药的恶性疟疾的辅助治 疗。（5)沙眼衣原体所致宫颈炎、尿道炎和新 生儿包涵体结膜炎。（6)与乙胺嘧啶联合用药 治疗鼠弓形虫引起的弓形虫病。

【注意事项〗（1)缺乏葡萄糖-6-磷酸脱 氢酶、血卟啉症、失水、休克和老年患者慎用。

(2)对一种磺胺药呈现过敏的患者对其他磺胺 药可能过敏。（3)治疗中须注意检查：①全血象检查，对接受较长疗程的患者尤为重要。 ②治疗中定期尿液检查（每2 ~3日查尿常规1 次）以发现长疗程或高剂量治疗时可能发生的 结晶尿。③肝、肾功能检查。（4)在尿中溶解度低，易出现结晶尿，不推荐用于尿路感染。 (5)本品能抑制大肠埃希菌的生长，妨碍B族维生素的肠内合成，使用1周以上者，应同时 给予维生素B预防。（6)注射液不宜做皮下或鞘内注射。

1. 甲氧苄啶

【适应证】用于敏感的大肠埃希菌、奇异变 形杆菌、肺炎克雷伯菌和某些肠杆菌属和腐生 葡萄球菌等细菌所致的急性单纯性下尿路感染 初发病例。单独应用易产生耐药性，一般均与 磺胺药如磺胺甲噁唑或磺胺嘧啶合用。

【注意事项〗（1)肝或肾劝能损害、叶酸 缺乏的巨幼细胞贫血或其他血液系统疾病患者、 妊娠及哺乳期妇女慎用。（2)应用甲氧苄啶时，可出现白细胞减少、血小板减少或高铁血 红蛋白性贫血。用药期间应定期进行周围血象 检查，在疗程长、用药量大、老年、营养不良 及服用抗紫癜药者易出现叶酸缺乏症，如周围 血白细胞或血小板等已明显减少则需停用。如 因服用本品引起叶酸缺乏时，可同时服用叶酸。 如有骨髓抑制征象发生，应立即停用本品，并 给予叶酸治疗。（3)本品可空腹服用，如有胃 肠道刺激症状时也可与食物同服。

1. 抗结核分枝杆菌药
2. 异烟肼

合成抗结核药物的代表药物是异烟肼及其腙的衍生物，其分子中的酰 肼基可与铜离子、铁离子、锌离子等金属离 子络合，异烟肼与食物和各种耐酸药物，特别是含有铝的耐酸药物等同时服用时，可以干扰或延误吸收。

【适应证〗单用适用于各型结核病的预防: (1)新近确诊为结核病患者的家庭成员或密切 接触者。（2)结核菌素纯蛋白衍生物试验强阳 性同时胸部X射线检查符合非进行性结核病， 痰菌阴性，过去未接受过正规抗结核治疗者。

(3)正在接受免疫抑制剂或长期激素治疗者, 某些血液病或网状内皮系统疾病（如白血病、何杰金病）、糖尿病、尿毒症、矽肺或胃切除术等患者，其结核菌素纯蛋白衍生物试验呈阳性反应者。（4) 35岁以下结核菌素纯蛋白衍生物试验阳性的患者。（5)已知或疑为HIV感染者，其结核菌素纯蛋白衍生物试验呈阳性反应 者，或与活动性肺结核患者有密切接触者。

(6)与其他抗结核药联合，适用于各型结核病 的治疗，包括结核性脑膜炎以及其他分枝杆菌 感染。

【注意事项〗（1)精神病、癫痫、肝功能 损害及严重肾功能损害者应慎用本品或剂量酌减。（2)与吡嗪酰胺、烟酸或其他化学结构有 关药物存在交叉过敏。（3)大剂量应用时，可使维生素队大量随尿液排出，抑制脑内谷氨酸 脱羧变成γ-氨基丁酸而导致惊厥，也可引起周围神经系统的多发性病变。因此成人一曰同 时口服维生素B50 ~ l00mg有助于防止或减轻 周围神经炎及（或）维生素队缺乏症状。如出 现轻度手脚发麻、头晕，可服用维生素队或 B，若重度者或有呕血现象，应即停药。

1. 肾功能减退但血肌酐值<6mg/100ml者， 异烟肼的用量勿需减少。如肾功能减退严重或 患者系慢乙酰化者则需减量，以异烟肼服用后 24h的血浆药物浓度不超过lmg/L为宜。在无 尿患者，异烟肼的剂量可减为常用量的一半。（5）肝功能减退者剂量应酌减。（6）用药前、 疗(5)程中应定期检查肝功能，包括血清胆红素、 AST、ALT,疗程中密切注意有无肝炎的前驱症 状，一旦出现肝毒性的症状及体征时应即停药， 必须待肝炎的症状、体征完全消失后方可重新 用药，此时必须从小剂量开始，逐步增加剂量， 如有任何肝毒性表现应即停药。（7)如疗程中出 现视神经炎症状，需即进行眼部检查，并定期 复查。（8)慢乙酰化患者较易产生不良反应， 故宜用较低剂量。（9)异烟肼可透过胎盘屏 障，导致胎儿血浆药物浓度高于母体血浆药物 浓度。妊娠期妇女应避免应用，如确有指征应 用时，须充分权衡利弊。（1〇)异烟肼在乳汁 浓度可达12ug/ml，与血浆药物浓度相近;如 哺乳期间用药，则宜停止哺乳。（11)新生儿肝 脏乙酰化能力较差，以致消除半衰期延长，用 药时应密切观察不良反应。（12) 50岁以上患 者用药引起肝炎的发生率较高，治疗时更需密 切注意肝功能的变化，必要时减少剂量或同时 酌情使用保肝药。
2. 吡嗪酰胺

吡嗪酰胺是烟酰胺的生物电子等排体，具有足够的亲水性以 确保其血浆中有足够的浓度，能使药物在感染 部位被释放；有一定的亲脂性以确保穿透结核菌的细胞；具有在作用部位易水解，而在其他 部位不易被水解的特点。

【适应证〗联合用于治疗结核病。

〖注意事项〗（1)交叉过敏，对乙硫异烟 胺、异烟肼、烟酸或其他化学结构相似的药物 过敏患者可能对吡嗪酰胺也过敏。（2)糖尿 病、痛风或严重肝功能减退者慎用。（3)本品 可使血尿酸增高，可引起急性痛风发作，须定 时测定。（4)妊娠期中的结核病者可先用异烟 肼、利福平和乙胺丁醇治疗9个月，如对上述 药中任一种耐药而对吡嗪酰胺可能敏感者可考 虑米用。

1. 烟酰胺
2. 乙胺丁醇

乙胺丁醇含两个构型相同的手性碳，分子呈对称性仅有三个旋光异构体， 右旋体的活性是内消旋体12倍，为左旋体的 200〜500倍，药用为右旋体。

【适应证】联合治疗用于结核杆菌所致的肺 结核，结核性脑膜炎及非典型分枝杆菌感染。

【注意事项〗（1)痛风、视神经炎、肾功 能不全者慎用。（2)治疗期间应监测眼部视野、视力、红绿鉴别力等5在用药前、疗程中 一日检查1次，尤其是疗程长，日剂量超过15mg/kg者。（3)乙胺丁醇可使血尿酸浓度增高，引起痛风发作。应定期监测。（4) 一日剂量宜顿服。（5)单用时可迅速产生耐药性，必 须与其他抗结核药联合应用。（6)肾功能不全或老年患者应用时需减量。（7)本品可透过胎 盘屏障，胎儿血浆浓度约为母体血浆浓度的30%，妊娠期妇女慎用。本品可由乳汁中分泌，哺乳期妇女慎用。

1. 抗真菌药
2. 咪康唑

咪康唑分子中含有双 2，4-二氯苯基，具有弱碱性，pKa为6. 65。咪 康唑口服吸收差，半衰期约为2. 1小时，血清蛋白结合率为90%。

1. 益康唑

将咪康唑分子中的一个2, 4- 二氯苯基由4-氯苯基替代得到益康唑。

1. 酮康唑

酮康唑是分子中含有乙酰哌嗪和缩酮结构可口服的咪唑 类抗真菌药物。

1. 氟康唑

1,2,4-三氮唑类结构的代表药物结构屮含有二个弱碱性的三氮唑环和一个亲脂性的2, 4-二氟苯基，使其具有一定的水溶解度。

【适应证〗用于：（1)念珠菌病：口咽部、和食管念珠菌感染；播散性念珠菌病，包括腹 膜炎、肺炎、尿路感染等；念珠菌外阴阴道炎。 骨髓移植患者接受细胞毒类药或放射治疗时， 预防念珠菌感染的发生。（2)隐球菌病：治疗' 脑膜炎以外的新型隐球菌病或治疗隐球菌脑膜 炎时，作为两性霉素B联合氟胞嘧啶初治后的 维持治疗药物。（3)球孢子菌病。（4)接受化 疗、放疗和免疫抑制治疗患者的预防治疗。 (5)可替代伊曲康唑用于芽生菌病和组织胞浆 菌病的治疗。

【注意事项〗（1)与其他吡咯类药可发生 交叉过敏反应，因此对任何一种吡咯类药物过 敏者都应禁用氟康唑。（2)需定期监测肝、肾 功能，用于肝肾功能减退者需减量应用。（3)在 免疫缺陷者的长期预防用药，已致念珠菌属等 对氟康唑等吡咯类抗真菌药耐药性的增加，应 避免无指征预防用药。（4)治疗过程中可发生 轻度肝脏氨基转移酶AST及ALT —过性升高， 偶可出现肝毒性，治疗前、后均应定期监测 肝功能，如出现持续异常或肝毒性临床症状 时应即停用。（5)与有肝毒性药合用、需服 用氟康唑2周以上或接受多倍于常用剂量的 本品时，可使肝毒性的发生率増髙，需严密 观察。（6)疗程应视感染部位及个体治疗反 应而定。一般治疗应持续至真菌感染的临床 表现及实验室检查指标显示真菌感染消失为 止。隐球菌脑膜炎或反复发作口咽部念珠菌 病的艾滋病患者需用氟康唑长期维持治疗以 防止复发。（7)接受骨髓移植者，如严重粒 细胞减少已先期发生，则应预防性使用，直 至中性粒细胞计数上升至1. 0 x 109/L以上后 7日。（8)哺乳期妇女慎用或服用时暂停哺乳。

(9)儿童不宜应用。（10)老年患者须根据肌 酐清除率调整剂量。（11)大剂量服用氟康唑 者禁止同时服用特非那定。（12)接受氟康唑 治疗者禁止同时服用西沙必利。

1. 伊曲康唑

伊曲康唑结构中含有1，2, 4-三氮唑和1，3, 4-三氮唑，且这两个唑基分别在苯基取代哌嗪的两端，这使得伊曲康唑脂溶性比较强，因此在体内某些脏器组织中浓度较高。

适应证〗用于：（1)妇科：外阴及阴道 念珠菌病。⑵皮肤科/眼科: '花斑癣、皮肤真菌 病、真菌性角膜炎和口腔念珠菌病。（3)皮肤癖菌和（或）酵母菌引起的甲真菌病。（4)系统 性真菌感染：系统性曲霉病及念珠菌病、隐球 菌病（包括隐球菌性脑膜炎）、组织胞浆菌病、 孢子丝菌病、巴西副球孢子菌病、芽生菌病和 其他各种少见的系统性或热带真菌病。

【注意事项】（1)对持续用药超过1个月 者，治疗过程中如出现厌食、疲劳、腹痛或尿 色加深的患者，建议检查肝功能。如果出现异 常，应停止用药。（2)肝功能异常患者慎用 (除非治疗的必要性超过肝损伤的危险性）。肝 硬化患者，使用时应考虑调整剂量，并监测肝 酶。（3)当发生神经系统症状时应终止治疗。

(4)患者肌酐清除率矣30ml/min时，不得使用 伊曲康唑静脉给药。（5)不应用于患有充血性 心力衰竭或有充血性心力衰竭病史的患者，除 非利明显大于弊。对个体的利弊评估应考虑到 的因素有病症的严重程度、给药方式（如日剂 量）和充血性心力衰竭的个体危险因素。这些 危险因素包括心脏疾病，如缺血性或瓣膜性心 脏病•，严重的肺部疾病，如慢性阻塞性肺病； 肾衰竭和其他水肿性疾病。医生应告知此类患 者有关充血性心力衰竭的体征和症状，并谨慎 用药，且在治疗中监测其充血性心力衰竭的体 征和症状。如果在治疗中出现这些体征和症状， 则应停止伊曲康唑的治疗。（6)钙通道阻滞剂 具有负性肌力作用，当合并使用伊曲康唑和钙 通道阻滞剂时发生充血性心力衰竭的风险升高， 需加注意。（7)对其他唑类药过敏的患者使用 伊曲康唑注射液时应慎重。（8)伊曲康唑注射 液只能用随包装提供0. 9%氯化钠注射液50ml 稀释。（9)妊娠期妇女禁用（除非用于系统性真 菌病治疗)。（10)哺乳期妇女不宜使用。(11)育 龄妇女使用时应采取适当的避孕措施，直至停止 伊曲康唑治疗后的下一个月经周期。（12)不用于 儿童患者，除非潜在利益优于可能出现的危害。 (13)老年患者的剂量选择应慎重。

1. 伏立康唑

伏立康唑是为改善氟康唑水溶性设计得到的衍生物。

〖适应证〗用于：（1)侵袭性曲霉病。（2)非中性粒细胞减少患者的念珠菌血症。（3)对氟 康唑耐药的念珠菌引起的严重侵袭性感染（包 括克柔念珠菌）。（4)由足放线病菌属和镰刀菌属引起的严重感染。

【注意事项〗（1)已知对其他唑类药过敏 者慎用。（2)极少数使用者发生了尖端扭转型 室性心动过速，伴有心律失常危险因素者需慎 用。（3)治疗前、治疗期间应监测血电解质5 如有电解质紊乱应及时纠正。（4)连续治疗超 过28日者，需监测视觉功能，包括视敏度、视 力范围以及色觉。（5)伴有严重基础疾病（主 要为恶性血液病）的患者可发生肝毒性反应。 肝脏反应，包括肝炎和黄疸，可以发生在无其 他确定危险因素的患者中。停药后即能好转。 治疗前及治疗中需检查肝功能，以防发生更严 重的肝脏损害。一旦发生应考虑停药。轻度到 中度肝硬化者（Child - Pugh A和B)的负荷剂 量不变，但维持剂量减半。严重肝功能不全的 患者应用本品时必须权衡利弊，并密切监测药 物的毒性反应。（6)片剂应在餐后或餐前至少 服用，其中含有乳糖成分，先天性的半乳糖 不能耐受者、乳糖酶缺乏或葡萄糖-半乳糖吸 收障碍者不宜应用片剂。（7)可能引起视觉改 变，包括视物模糊和畏光，使用期间应避免从 事有潜在危险性的工作，如驾驶或操纵机器。

(8)在治疗中患者出现皮瘆需严密观察，如皮 损进一步加重则需停药。用药期间应避免强烈 的、直接的阳光照射。（9)用药期间必须监测 肾功能（血肌酐）。中度到严重肾功能减退 (肌酐清除率矣50ml/min)的患者应用注射液

时，可能发生助溶剂蓄积。除非应用静脉制剂 的利大于弊，否则应选用口服给药。肾功能障 碍者静脉给药时必须密切监测血肌酐水平，如 有升高应考虑改为口服给药。（10)伏立康唑 可经血液透析清除，清除率为121ml/min。4h 的血液透析仅能清除少许药物，无需调整剂量。

(11)在用药期间怀孕，应告知患者本品对胎儿 的潜在危险。（12)哺乳期妇女和儿童患者慎用。