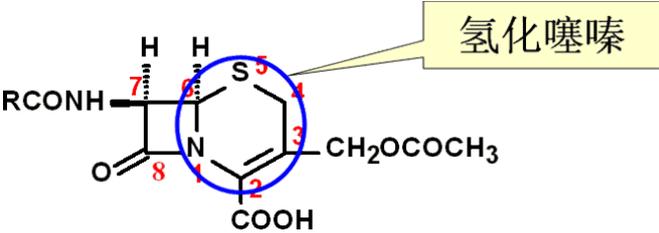
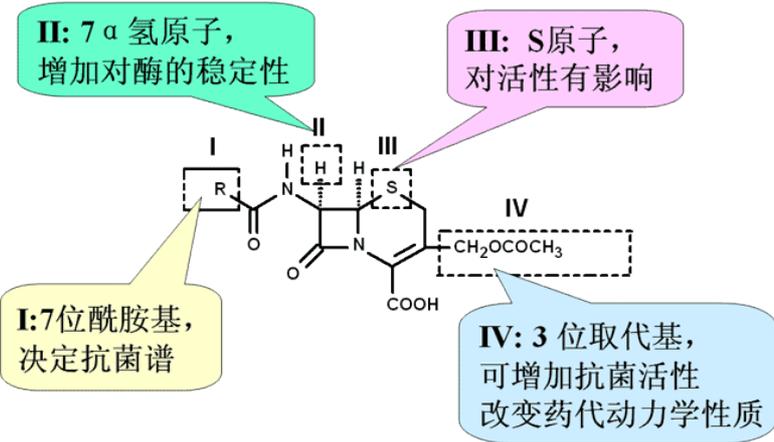


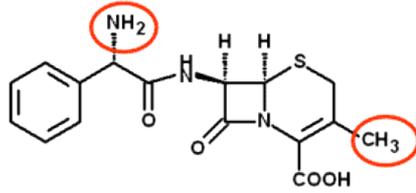
# 山西药科职业学院

## 教学设计方案

课程：药物化学

授课内容		模块六 抗生素 单元一 $\beta$ -内酰胺类抗生素				
专业		药学、药检、药物制剂	课时	2	课型	理论课
教学目标	知识目标	1. 了解头孢菌素的结构改造部位。 2. 说出头孢菌素四代的划分、各代药物的作用特点及代表药物。 3. 了解其他 $\beta$ -内酰胺类抗生素。				
	能力目标	1. 写出头孢氨苄的化学结构并能说出其理化性质、结构特点、代谢特点、作用特点和用途。 2. 学会根据典型药物的结构特点推导其化学性质的方法。 3. 认识克拉维酸、头孢克洛、头孢哌酮、舒巴坦钠、氨曲南的化学结构并说出它们的作用特点和结构特点。				
	素质目标	树立正确的职业道德。				
德育渗透		口服青霉素也应做皮试。				
教学方法使用及教学媒体设计		1. 教学方法：讲授法、讨论法。 2. 教学媒体：多媒体、药品说明书、药品包装盒、板书。				
新知识新技术		头孢菌素类抗生素的发展。				
双语教学		Cefalexin 头孢氨苄 Cefotaxime Sodium 头孢噻肟钠				
重点难点及处理		重点：典型药物 难点：性质 处理：结构推导性质				
参考书目		《药物化学》 人民卫生出版社 刘文娟 主编 《药物化学》 中国医药科技出版社 刘文娟 主编				

授课内容	重点设计
<p><b>【前提诊断】</b></p> <p>1. 说出青霉素 G 的结构特点、稳定性。</p> <p>2. 说出半合成青霉素的类型及常用药物。</p> <p>2. β-内酰胺类抗生素除青霉素类外还有哪些？</p>	<p>5min</p> <p>教师提问</p>
<p><b>【导入新课】</b></p> <p>大家有没有听说过先锋霉素？</p>	<p>2min</p>
<p><b>【讲授新课】</b></p> <p>一、头孢菌素及半合成头孢菌素类</p> <div style="text-align: center;">  </div> <p><b>结构特点：</b>比青霉素稳定（双键与氮原子的未共用电子对形成共轭，四元环和六元环的耦合，张力较青霉素小）；</p> <p><b>临床应用特点：</b>对酸稳定、可口服、毒性小、与青霉素很少交叉过敏。</p> <p>半合成头孢菌素类      <b>词干：头孢 XX</b></p> <div style="text-align: center;">  </div> <p style="text-align: center;">头孢氨苄</p> <p>(一) 结构</p>	<p>65min</p> <p>板书</p> <p>比较</p>



**结构特点：**3位甲基，7位侧链氨基（同氨苄西林）。

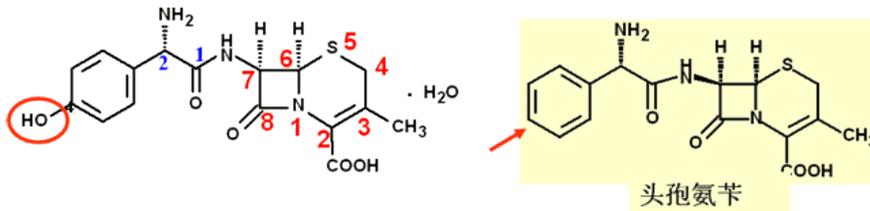
**(二) 性质及作用特点**

- (1) 除共性，对酸稳定
- (2) 对头孢菌素3位原来的乙酰氧基进行结构改造，明显改善抗菌效力和药代动力学性质。

比较

**头孢羟氨苄**

**(一) 结构**



**结构特点：**头孢氨苄的苯环对位羟基。

**(二) 作用特点：**

口服吸收好，排泄速度慢，作用时间长。

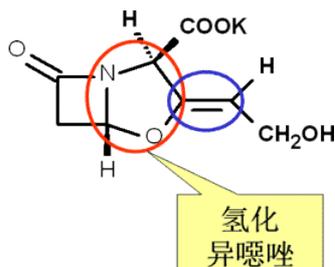
**二、β-内酰胺酶抑制剂**

β-内酰胺酶是细菌产生的酶，使某些β-内酰胺类抗生素在未到达细菌作用部位之前被酶分解失活，是细菌产生耐药性的主要机制。设计酶抑制剂，解决耐药性。

按结构分两类：

- 1. 氧青霉烷类

**克拉维酸钾**

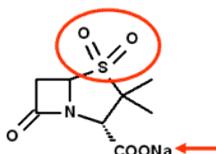


强调

- (1) 结构特点：氢化异恶唑，乙烯基醚，6位无酰胺侧链。
- (2) 第一个  $\beta$ -内酰胺酶抑制剂
- 作用机制特点：自杀性机制的酶抑制剂，不可逆。
- (3) 单独使用无效，与  $\beta$ -内酰胺类抗生素联合使用，如与阿莫西林制成复方制剂。

## 2. 青霉烷砜类

### 舒巴坦钠



- (1) 结构：青霉烷酸，S氧化成砜，比克拉维酸稳定。
- (2) 作用特点：广谱、不可逆竞争性。
- (3) 口服吸收差，与氨苄西林 1:2 混合。
- (4) 将氨苄西林与舒巴坦形成双酯结构的前体药物，称为舒他西林，体内水解，给出较高血清浓度的氨苄西林和舒巴坦。

### 课堂互动

你知道奥格门汀（力百汀）、特美汀、优力新、舒普深各是由哪二种药组成？说明二者合用增效的原理。

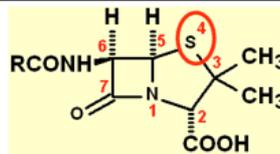
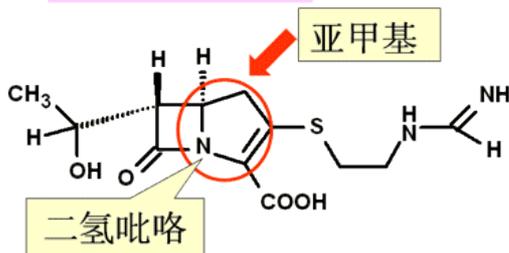
解析要点：奥格门汀（克拉维酸+阿莫西林）；特美汀（克拉维酸+替卡西林）；舒他西林（优力新）（舒巴坦+氨苄西林）；舒普深（舒巴坦+头孢哌酮）。以奥格门汀为例，阿莫西林为半合成的广谱青霉素，通过抑制细菌细胞壁的合成而发挥抗菌作用，但会被细菌所产生的  $\beta$ -内酰胺酶水解而失活。克拉维酸是有效的  $\beta$ -内酰胺酶抑制剂，可与多数  $\beta$ -内酰胺酶牢固结合，可使阿莫西林免受  $\beta$ -内酰胺酶的钝化，用于治疗耐阿莫西林细菌所引起的感染。

## 三、碳青霉烯类

前药

课堂互动

### 1、亚胺培南

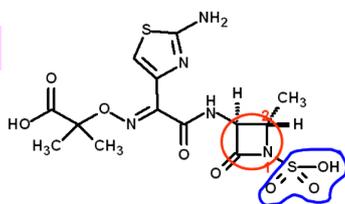


(1) 结构特点：去 S 为二氢吡咯环，3 位 S 末端 N-亚胺甲基，增加稳定性；

(2) 使用特点：单独使用时，受肾肽酶分解失活，需和酶抑制剂西司他丁钠合用。

### 四、单环 $\beta$ -内酰胺类

#### 氨曲南



(1) 第一个全合成的单环  $\beta$ -内酰胺抗生素；

(2) N 上连有强吸电子磺酸基；

(3) 2 位甲基，增加对酶稳定性；

(4) 副作用小，不发生交叉过敏。

#### 【课堂小结】

本节课复习了  $\beta$ -内酰胺类抗生素的分类，重点讲解了头孢菌素类、碳青霉烯类、单环类、 $\beta$ -内酰胺酶抑制剂的典型药物的化学结构、理化性质。同学们要学会根据化学结构推导理化性质。

5min

用彩色粉笔标示重点内容

#### 【布置作业】

- 1.总结所学官能团的性质；
- 2.说出头孢菌素结构改造的部位。
- 3.查资料：红霉素、链霉素。

3min

同学记录