

盐酸莫西沙星 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文
https://www.100test.com/kao_ti2020/309/2021_2022__E7_9B_90_E9_85_B8_E8_8E_AB_E8_c22_309593.htm 药品名称盐酸莫西沙星 药物别名拜复乐 Avelox 英文名称moxifloxacin HCl 类别喹诺酮类制剂薄膜衣片：400mg/片。干燥条件下储藏，盐酸莫西沙星片剂需储藏于生产者的原包装内。有效期2年。分子式成分 盐酸莫西沙星的化学名为1-环丙基-7-(S,S-2,8-重氮-二环[4.3.0]non-8-yl)-6-氟-8-甲氧-1,4-二氢-4-氧-3-喹啉羧酸氢氯化物。分子式：C₂₁H₂₄FN₃O₄HCl，分子量：437.9。本品为暗红色薄膜衣片。药理毒理作用机制 莫西沙星是广谱和具有抗菌活性的8-甲氧基氟喹诺酮类抗菌药。莫西沙星在体外显示出对革兰阳性细菌，革兰阴性菌，厌氧菌、抗酸菌和非典型微生物如支原体、衣原体和军团菌有广谱抗菌活性。抗菌作用机制为干扰II、IV拓扑异构酶。拓扑异构酶是控制DNA拓扑和在DNA复制、修复和转录中要害的酶。其杀菌曲线表明，莫西沙星是具有浓度依靠性的杀菌活性。最低杀菌浓度和最低抑菌浓度基本一致。莫西沙星对β-内酰胺类和大环内酯类抗生素耐药的细菌亦有效。通过感染的实验动物模型证实，莫西沙星体内活性高。耐药：导致对青霉素类、头孢菌素类、糖肽类、大环内酯类和四环素类耐药的耐药机制不影响莫西沙星的抗菌活性。莫西沙星和这些抗菌药无交叉耐药性。至今未发现质粒介导的耐药性的出现。莫西沙星的8-甲氧基部分与8-氢部分相比具有对革兰阳性菌高活性和耐药突变的低选择性。7位的二氮杂环取代能阻止活性流出，该活性流出为氟喹诺酮耐药机制。体外试验显示经过多步变异才能缓慢的出现对莫西沙星的耐药性。总之其耐药率很低

(10-7-10-10)。序列地将细菌暴露在低于莫西沙星MIC浓度时只能使MIC值有少量的增加。其他喹诺酮类之间存在交叉耐药。但是，一些对其他喹诺酮类耐药的革兰阳性菌和厌氧菌对莫西沙星敏感。对人类肠道菌群的作用：通过对两名志愿者服用莫西沙星后的研究观察到下列的变化：大肠杆菌、芽孢杆菌、普通拟杆菌、肠球菌、克雷白杆菌和厌氧菌如：双歧杆菌、真杆菌和消化链球菌等的减少。这些变化在2周内可以恢复正常，未发现艰难梭菌毒素。体外试验敏感数据：敏感-革兰阳性菌：肺炎球菌（包括青霉素和大环内酯类耐药菌株）、A组化脓链球菌、米氏链球菌、轻型链球菌、无乳链球菌、停乳链球菌、金黄色葡萄球菌（包括甲氧西林敏感菌）、科氏葡萄球菌、表皮葡萄球菌（包括甲氧西林敏感菌）、溶血葡萄球菌、人葡萄球菌、腐生葡萄球菌、模拟葡萄球菌、白喉棒状杆菌。革兰阴性菌：流感嗜血杆菌（包括产生和不产生b-内酰胺酶的菌株）、副流感嗜血杆菌、卡他莫拉菌（包括产生和不产生b-内酰胺酶的菌株）、百日咳博德特氏菌、大肠埃希氏杆菌、肺炎克雷白菌、产酸克雷白杆菌、产气肠杆菌、聚团肠杆菌、阴沟肠杆菌、中间肠杆菌、阪崎肠杆菌、奇异变形菌、普通变形菌、摩氏摩根菌，雷氏普罗威登斯菌、斯氏普罗威登斯菌。厌氧菌：吉氏拟杆菌、埃氏拟杆菌、脆弱拟杆菌、卵形拟杆菌、多形拟杆菌、单形拟杆菌、梭形杆菌属、卟啉单胞菌属、厌氧卟啉单胞菌、不解糖卟啉单胞菌、magnus卟啉单胞菌、普雷沃菌属、疮疱丙酸杆菌、产气荚膜梭菌、多枝梭菌。其他：肺炎衣原体、肺炎支原体、嗜肺军团菌、伯氏柯克斯体。对于任何细菌的获得性耐药可能随地理和时间而改变，但目前莫西沙星尚无这

方面的资料。局部耐药是可能出现的，非凡是治疗严重感染时。上述体外敏感试验结果可用来指导判定微生物是否对莫西沙星敏感。药动学单剂量静脉和口服给予400 mg莫西沙星的PK/PD比较。需住院病人的AUC/MIC₉₀值大于125并C_{max}/MIC₉₀为8-10为临床有效治疗期望值。门诊病人的参数值通常要低，AUC/MIC₉₀大于30-40。适应症患有上呼吸道和下呼吸道感染的成人（≥18岁），如急性鼻窦炎、慢性支气管炎急性发作、社区获得性肺炎，以及皮肤和软组织感染。不良反应在莫西沙星的临床试验中，绝大多数的不良反应为轻中度（大于90%），由于不良反应导致不能使用莫西沙星治疗的病人为3.6%。根据莫西沙星的临床试验总结出的常见不良反应（其相关程度分为很可能、可能和无法评估）列表如下：发生率 ≥1%且<10%：全身症状：乏力、念珠菌病、疼痛、不适、胸痛，心血管系统：心动过速、高血压、心悸、QT延长，消化系统：口干、恶心和呕吐、腹胀、便秘、口腔念珠菌病、食欲下降、胃炎、胃肠失调、舌炎、γ-谷氨酰胺转氨酶增高，血液和淋巴系统：白细胞减少、凝血酶原减少、嗜酸细胞增多，代谢和营养：淀粉酶增加，骨骼肌肉系统：关节痛、肌肉痛，神经系统：失眠、眩晕、神经质、嗜睡、焦虑、颤抖、感觉异常，呼吸系统：呼吸困难，皮肤和附件：皮疹、瘙痒、多汗，泌尿生殖系统：阴道念珠菌病、阴道炎。发生率 <0.01%且<0.01%）过敏反应：过敏性的反应、过敏性休克（可能威胁生命），消化系统：伪膜性肠炎，肌肉骨骼系统：肌腱断裂。相互作用慎与下列药物合用：1a类（如奎宁丁、普鲁卡因）或III类（如胺碘酮、索托洛尔）抗心律失常药、西沙必利、红霉素、抗精神病药物和三

环类抗抑郁药。 食物和乳制品：食物的摄入不影响莫西沙星的吸收。因此，莫西沙星的服用时间不受进食的影响。 抗酸药、矿物质和多种维生素：莫西沙星与抗酸药、矿物质和多种维生素同时服用会因为与这些物质形成多价螯合物而减少药物的吸收。这将导致血浆中的药物浓度比预定值低，因此，抗酸药、抗逆转录病毒、和其他含有镁、铝和其他矿物质如铁等的制剂需要在口服莫西沙星4小时前或2小时后服用。 雷尼替丁：与雷尼替丁同时服用不会影响莫西沙星的吸收特性，其吸收参数（ C_{max} ， T_{max} ， AUC ）均提示莫西沙星不受胃酸缺乏的影响。 钙补充剂：当给予高剂量补充剂时，仅观察到吸收率稍有减少，而吸收范围保持不变。高剂量钙补充剂对莫西沙星的吸收不具有临床意义。 茶碱：莫西沙星对稳态时茶碱的药代动力学无影响，提示莫西沙星对P450酶的1A2亚型无影响。当服用莫西沙星治疗时，达到稳态的茶碱浓度未升高。因此，服用莫西沙星时不必调整茶碱的用量。 华法令：据观察，莫西沙星与华法令同时服用未发现对凝血酶原时间和凝血的其他参数有影响。 口服避孕药：莫西沙星与口服避孕药同时服用未发现相互作用。 抗糖尿病药：优降糖和莫西沙星同时服用未发现相互作用。 伊曲康唑：莫西沙星与伊曲康唑同时服用时伊曲康唑的药时曲线下面积（ AUC ）仅少量改变。伊曲康唑对莫西沙星的药代动力学无显著性影响。当服用伊曲康唑时给予莫西沙星不需要调整剂量，反之亦然。 地高辛：莫西沙星对地高辛的药代动力学没有严重影响。反之亦然。 吗啡：肠外给予吗啡同时服用莫西沙星，并不减少口服莫西沙星的生物利用度，且 C_{max} (17%)仅稍有下降。 普鲁苯辛：在一项观察普鲁苯辛对肾脏排泄功

能影响的研究中未发现对莫西沙星的全身清除和肾脏清除有明显影响。因此，当这两种药同时服用时不必调整剂量。炭：同时口服炭及400 mg莫西沙星能减少药物的全身利用、在体内能阻止80%药物吸收。药物过量时，利用活性炭能在吸收早期阻止药物的进一步进入全身系统。用法用量剂量范围：一次400 mg（1片），1日1次。成年人服用方法：片剂用一杯水送下，服用时间不受饮食影响。治疗时间：治疗时间应根据症状的严重程度或临床反应决定。治疗上呼吸道和下呼吸道的感染时可按照下列方法：慢性气管炎急性发作：5天，社区获得性肺炎：10天，急性鼻窦炎：7天，治疗皮肤和软组织感染的推荐治疗时间为7天，莫西沙星400 mg片剂在临床试验中最多用过14天疗程。老年人：老年人不必调整用药剂量。儿童：儿童和发育阶段的青少年不建议使用莫西沙星。肝损伤：轻度肝功能异常（Child-Pugh A，B）的患者不必调整莫西沙星的剂量。目前尚缺乏严重肝功能受损者（Child-Pugh C）的药代动力学数据。肾功能异常：任何程度的肾功能受损的病人都无需调整莫西沙星的剂量（包括肌酐清除率 30 mL/分/1.73 m^2 。目前缺乏透析病人的药代动力学数据。种族差别：不同种族间不必调整药物剂量。用药过量 关于过量的研究资料非常有限，单次最大剂量800 mg和每日600 mg多次口服，连用10天在健康志愿者身上未发现有任何明确不良反应。一旦服用过量莫西沙星时，应根据患者状况采取适当支持措施。 注重事项已知对该片剂的任何成份或其他喹诺酮类高度过敏者禁用。喹诺酮类使用可诱发癫痫的发作，对于已知或怀疑有能导致癫痫发作或降低癫痫发作域值的中枢神经系统疾病的病人，莫西沙星在使用中要注重。

由于缺乏患有肝功能严重损伤病人使用莫西沙星时的药代动力学和药效动力学的的数据，不推荐该药在这类病人中使用。莫西沙星象其他喹诺酮类和大环内酯类抗生素一样在有些患者可能延长QT间期。因为缺乏相关的临床资料，该药应避免用于QT间期延长的病人。患有低钾血症或接受1a类（如奎宁丁、普鲁卡因）或III类（如胺碘酮、索托落尔）抗心律失常药物治疗的病人，在使用莫西沙星时应慎用。莫西沙星与下列药物合用不排除有延长QT间期的效应：西沙必利、红霉素、抗精神病药物、和三环类抗抑郁药，所以，应慎重与这些药物合用。因为临床资料有限，莫西沙星在有致心律失常的因素（如严重的心动过缓或急性心肌缺血）存在时应慎用。QT间期延长的程度随着药物浓度的增加而增加，所以不应超过推荐剂量。QT间期延长可导致室性心律失常包括尖端扭转型室速的发生危险。在莫西沙星治疗的超过4000名患者中，没有心血管的发病率或死亡率归因于QT间期延长，但某些潜在条件可以增加室性心律失常的危险。在使用喹诺酮类治疗中有可能出现肌腱炎和肌腱断裂，非凡是在老年病人和使用激素治疗的病人中。一旦出现疼痛或炎症，患者需要停止服药并休息患肢。有报导，在使用包括莫西沙星在内的广谱抗生素中出现伪膜性肠炎，因此，在使用莫西沙星治疗中如患者出现严重的腹泻，需要考虑这个诊断，这一点很重要。在这种情况下需立即采取足够的治疗措施。光敏感性：其他喹诺酮类有导致光过敏的报导。但是，在一项健康志愿者中进行的试验未发现光过敏的出现。尽管如此，应建议病人避免在紫外线及日光下过度暴露。在有些病例，首次服用后就可发生过敏反应和变态反应。过敏性反应在极少的病例能

够在首次服用后导致发生威胁生命的休克。在这些病例莫西沙星应停用并给予治疗（如针对休克的治疗）。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com