

格帕沙星 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__E6_A0_BC_E5_B8_95_E6_B2_99_E6_c22_309622.htm 药品名称格帕沙星 药物别名格雷沙星 OPC-17116 英文名称grepafloxacin 类别喹诺酮类制剂片剂。分子式成分分子式为： $C_{19}H_{22}FN_3O_3$ ，分子量为395.86，其CAS号为161967-81-3。本品为白色粉末，水中溶解度很小，故常以其盐酸盐溶于水供制作片剂的原料。药理毒理是由日本大冢制药株式会社生产改进的第三代氟喹诺酮类抗菌药。该药为90年代初开发，后转让给英国格兰素-威尔康(Glaxo-Wellcome)公司，于1996年3月向欧洲(德国为参照国)提出申请，同年8月向美国FDA提出申请，现已进入 期临床试验阶段，美国采用药名委员会(USAN Council)已经在383号目录表中正式公布，FDA于1997年12月正式批准上市。格帕沙星的化学结构与环丙沙星相似，但在5位上取代有甲基，在7位的哌嗪环上有3-甲基取代，根据对氟喹诺酮类抗菌药物构效关系研究的规律表明，格帕沙星一日一次给药，组织渗透力强，抗菌谱广，甚至对衣原体也有效。对肺炎链球菌等革兰阳性菌效果显著，如对青霉素耐药的肺炎链球菌造成的社区获得性肺炎(community-acquired pneumonia)比环丙沙星的疗效要强4倍，其它如光毒性、药物相互作用及不良反应等均比现有的氟喹诺酮类抗菌药少见。Marco等 [1] 在日、美、欧盟等六国的多中心国际研究中，从临床分离了6000株以上的细菌，对格帕沙星的体外抗菌活性进行了研究。结果表明其对绝大多数革兰阴性菌和很多革兰阳性菌具有抗菌活性：对肠球菌的抗菌作用与环丙沙星相似或稍弱，但对绝大多数革兰阳性菌其抗菌活性优于环丙沙星；对苯唑西林耐药的

金葡菌和凝集酶呈阴性的葡萄球菌，格帕沙星与环丙沙星的效果相同，但对肠球菌和苯唑西林敏感的金葡菌其体外抗菌效果强于环丙沙星。对潜在的呼吸道病原体如肺炎链球菌、流感噬血杆菌、卡他性摩拉菌、克帕白肺炎球菌、肺炎衣原体、肺炎支原体等的体外活性相似或优于环丙沙星，对肺炎链球菌的体外抗菌活性至少比环丙沙星要强4倍，而对肺炎支原体的活性则比环丙沙星强8倍。格帕沙星对淋球菌(MIC#061.0.03 ~ 0.06mg.L-1)均具有良好的体外活性。药动学单次服用格帕沙星400mg，服药后2 ~ 5h，血药浓度达峰值平均为1.5 ~ 5.2mg.L-1，在炎性液中的药物浓度在4 ~ 5h达高峰，平均为1.1mg.L-1。服药后24h尿中回收8.3%，大部分经肝脏代谢后由粪便排出体外。Cook等 [2] 对24名胸片异常或咯血的患者给予格帕沙星400mg.d-1，连续用药4d，用药后4 ~ 5h血药浓度达峰值，平均为1.8mg.L-1，而此时药物在支气管粘膜、皮下组织液、肺泡巨噬细胞中的浓度分别为5.3，27.1和278.4mg.L-1，分别为血清中浓度的2.9，15.1和154.3倍，表明格帕沙星的组织渗透力很强，优于环丙沙星等药物。格帕沙星在血浆和炎性液中的消除半衰期均约为12h，故适合于1日1次或1日2次给药。适应症呼吸道感染，如肺炎、急慢性支气管炎及革兰阴性杆菌性肺炎等；泌尿生殖系统感染，如尿路感染、宫颈炎、前列腺炎、淋球菌感染等；也适用于消化道感染、皮肤及软组织感染等。不良反应格帕沙星的主要不良反应为恶心、腹泻、头痛、头晕及皮疹等，发生率在2% ~ 10%，多只是轻中度反应，2% ~ 5%可发生试验室参数异常，主要为肝脏酶的短暂升高。相互作用格帕沙星可抑制茶碱的正常代谢，使其消除减慢，血药浓度升高，合用时需注重

。亦不宜与氢氧化镁或氢氧化铝等抗酸药同服，以免影响格帕沙星的吸收。用法用量成人一般用量为1日1次200～400mg口服，儿童用量酌减。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