

帕珠沙星 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__E5_B8_95_E7_8F_A0_E6_B2_99_E6_c22_309629.htm 药品名称帕珠沙星药物别名甲磺酸帕苏沙星 Pasil 英文名称 pazufloxacin

methanesulfonate 类别喹诺酮类制剂注射剂：100mg、200 mg。滴眼液分子式成分(S)-(-)-10-(1-氨基环丙基)-9-氟-3-甲基-7-氧代-2,3-二氢-7H-吡啶并[1,2,3-de][1,4]苯并恶嗪-6-羧酸甲磺酸盐。药理毒理【药理毒理】富山化学开发 本品为第三代喹诺酮类抗菌药，作用机理为DNA拓扑异构酶抑制剂，使细菌的DNA无法形成超螺旋结构，导致细菌细胞无法分裂和增殖而死亡，体内抗菌活性研究表明，本品对金黄色葡萄球菌、甲氧西林耐药株、肺炎链球菌、大肠杆菌、肺炎杆菌粘质沙雷氏菌和绿脓杆菌等MIC50为2.8、4.5、150、0.15、5.5、1.1、8.0 μg/ml，强于氧氟沙星。对临床分离的链球菌MIC90为3.13 μg/ml，强于亚胺培南（Imipenem）和环丙沙星，对喹诺酮敏感的葡萄球菌MIC90为0.2 ~ 6.25 μg/ml，强于头孢他啶（Ceftazidime）。另一项实验研究表明，对头孢类耐药的大肠杆菌和绿脓杆菌帕珠沙星的MIC90为0.025 ~ 50 μg/ml。对革兰氏阴性菌本品的ED50为亚胺培南的4 ~ 120倍，对葡萄球菌活性与Flomoxef相当，强于头孢他啶和左旋氧氟沙星。肺炎和慢性支气管炎患者，给药剂量为每次300 mg和500 mg，天天2次，对慢性气管炎患者有效率为76.1%，对肺炎和肺化脓患者有效率为75.7%，总有效率为75.1%。对服用其它抗菌药无效的患者给予本品的有效率为63.3%。总体对细菌的清除率为69.2%。对呼吸系统感染的有效率，总体为72.9%，在天天600 mg剂量下有效率为71.4%，在天天1000

mg剂量下有效率为72.6%。甲磺酸帕珠沙星治疗复杂尿路器官感染给药剂量为每次300 mg或500 mg，天天2次，本品对肾盂肾炎患者本品有效率为75.9%，对膀胱炎患者有效率为80.7%。对服用其它抗菌药无效的患者给予本品的有效率为63.3%。对细菌的清除率两个剂量组对革兰氏阳性菌为85.9%和79.3%，对革兰氏阴性菌为91.9%。药动学52位男性健康志愿者单剂量给予甲磺酸帕珠沙星剂量为50、100、200、400和500 mg静脉滴注30 min，或多剂量静脉给予300 mg或500 mg，天天2次，500 mg，天天3次，连续5天。试验研究表明，单剂量给予本品出现血浆药物浓度与给药剂量呈线性关系，在给药30 min即给药结束后检测到最大血浆药物浓度，为1.28、2.68、4.61、9.93和11.0 $\mu\text{g/ml}$ ，半衰期为1.74 ~ 1.88 h。C_{max}和AUC值与给药剂量呈线性关系。在给药后24 h尿液分泌率与给药剂量相差很小，为89.5% ~ 93.9%。在多剂量给药1天后血浆药物浓度达到平台，尿液排泄未见药物累积。在滴注时间对最大血浆药物浓度的影响，在静脉滴注60 min的C_{max}为滴注30 min的80%。适应症革兰氏阳性菌和阴性菌感染，如支气管及肺部感染、细菌性痢疾、泌尿系统、皮肤和软组织等感染。不良反应本品普遍易于耐受，总的不良反应发生率与安慰剂相似。常见副作用为：消化道反应如恶心、上腹不适和腹胀等，个别患者出现皮疹、瘙痒等。相互作用本品与茶碱同用不影响茶碱的药物代谢，氢氧化铝可抑制本品的胃肠道吸收，西咪替丁可使本品C_{max}下降，但不影响其吸收程度（AUC）。用法用量甲磺酸帕珠沙星治疗复杂尿路器官感染给药剂量为每次300 mg或500 mg，天天2次。注重事项对喹诺酮类抗菌药过敏者禁用。孕妇及哺乳期

妇女禁用。患者使用本品后避免在阳光下爆晒。轻至中度肾功能损伤患者需降低本品的给药剂量。#093. 孕妇及哺乳期妇女禁用本品。#093. 儿童患者使用本品的安全性尚未确立，儿童慎用。#093. 药代动力学研究表明肝肾功能不全的老年患者血浆最大药物浓度较正常人略高，半衰期延长，应调整本品的剂量 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