

曲氟沙星 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_9B_B2_E6_B0_9F_E6_B2_99_E6_c22_309636.htm 药品名称曲氟沙星 英文名称trovafloxacin 类别抗痛风药制剂片剂。分子式成分 药理毒理美国食品药品监督管理局(FDA)于1997年1月批准上市的氟喹诺酮类药物。 曲氟沙星为氟喹诺酮类抗生素，与早期同类药物环丙沙星(ciprofloxacin)和氧氟沙星(ofloxacin)比较，曲氟沙星有较高的抗革兰阳性菌活性，尤其对肺炎链球菌(*Streptococcus pneumoniae*)作用显著。它的消除半衰期大约为10h，使得其对许多感染可采取每日一次的给药方案。最佳杀菌浓度(optimum bactericidal concentrations, OBC)研究表明，对于大肠埃希菌和金葡菌，曲氟沙星的杀菌机制是不参与活性蛋白或RNA合成，对非分裂菌具有活性。然而，对于肺炎链球菌，曲氟沙星的杀菌机制是参与细菌复制和蛋白或RNA合成。体外研究表明，曲氟沙星对大多数链球菌属(*Streptococci*)包括肺炎链球菌(*S. pneumoniae*)的最小抑菌浓度MIC₉₀为0.06 ~ 0.25 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ ，对大多数葡萄球菌属(*Staphylococci*)为0.06 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 或更低。耐青霉素(penicillin-resistant)的肺炎链球菌可在0.25 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 或更低水平上被抑制。对耐甲氧西林(methicillin-resistant)的金葡菌和凝固酶阴性的葡萄球菌的抑制浓度分别为4, 2 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 。对于肠球菌MIC₉₀为0.5 ~ 8 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 。对于大多数分离的肠杆菌浓度为0.1 ~ 1 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 绿脓杆菌和厌氧菌MIC₉₀为1 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 或更低；沙眼衣原体通常为0.06 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 或更低；奈瑟球菌和嗜肺军团菌低于0.005 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 。体外研究表明，曲氟沙星抗链球菌属、葡萄球菌属、肠球菌属和大多数厌氧菌(包括脆弱拟杆

菌)的活性优于环丙沙星和氧氟沙星；然而这三个药物对抗绿脓杆菌和肠杆菌的活性相似。曲氟沙星抗淋病菌株的体外活性优于环丙沙星和氧氟沙星；且具有较高的抗沙眼衣原体(*chlamydia trachomatis*)和衣原体肺炎(*chlamydia pneumoniae*)作用。药动学曲氟沙星口服后迅速吸收，约1 h 达血清峰浓度，口服生物利用度约为90%。药物的血浆蛋白结合率为75%。肺组织浓度高，多剂量给药，每日口服200 mg后支气管粘膜药物浓度与血清药物浓度平行；6 h 上皮内液和肺泡巨噬细胞内浓度分别是相应血清浓度的2到14倍。脑脊液浓度约为相应血清浓度的25%；曲氟沙星经肝代谢，口服后约5%的药物以原形自尿排泄。消除半衰期为10 h。健康受试者单剂量口服每日一次100 mg 或300 mg 曲氟沙星后，平均血清峰浓度分别为1, 2.9 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 。这些受试者接受100 mg和300 mg多剂量给药，9, 14d后，蓄积最小，日蓄积因子约为1.25；两周后各自血清峰浓度为1.1 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 和3.3 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ ；100 mg, 9, 14d内平均血清谷浓度大约为0.2 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ ；天天口服300 mg，血清谷浓度为0.5 ~ 0.7 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 。与其它常用的氟喹诺酮类药物环丙沙星、洛美沙星(*lomefloxacin*)和氧氟沙星不同，曲氟沙星单剂量或多剂量口服100mg或300mg后，大约仅有5%的原形药物出现在24h尿中，肾清除率为0.4 ~ 0.5L.h⁻¹。单剂量口服100mg和300mg，在12 ~ 24h内，原形药物的平均尿药浓度为2 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ 和4 $\mu\text{g}\cdot\text{ml}^{-1}$ ；药物的低肾清除率或许与相对高的蛋白结合率有关。粪清除是曲氟沙星的主要消除途径，放射活性显示单剂量口服200mg后，240h内大约有63.3%的药物出现于粪便中。适应症\与其它常用氟喹诺酮类药物比较，曲氟沙星的特点在于可每日给药一次，并对多数耐药的革兰阳性

菌，包括葡萄球菌属、链球菌属和肠球菌等具有较高的活性。曲氟沙星显示有希望作为单一药物在治疗厌氧菌和需氧菌混合感染中发挥作用。其抗肺炎链球菌的活性，建议用于社区获得性肺炎的治疗。然而在治疗耐药的革兰阳性菌感染以及对其它氟喹诺酮类药物耐药感染的疗效，有待于进一步评价。有限的研究表明，曲氟沙星对淋病、流行性脑膜炎及沙眼衣原体感染有效。不良反应曲氟沙星的不良反应与其它氟喹诺酮类药物相似，有报道为头晕、头痛、嗜睡、恶心及皮疹等。静脉输液后可发生静脉炎。动物试验表明曲氟沙星对于生长骨及软骨无副作用，但尚缺乏用于小儿科治疗方面的数据，目前曲氟沙星还不被用于伴有严重和/或耐药感染儿童的治疗，除非无适当的选择。曲氟沙星可诱导中枢神经系统副作用的产生；且其在肝脏代谢，需要时做剂量调整。尽管口服曲氟沙星后仅有少量原形药物自肾排泄，但缺乏有关肾功能不全患者的非凡药代动力学研究资料。相互作用对照试验表明，曲氟沙星与茶碱合用，可使茶碱曲线下面积(AUC)和半衰期稍微增加，但被认为没有临床意义。可能的机制为降低茶碱清除率。健康受试者研究未显示对华法林药效学和药代动力学方面的作用，但有关对需预防凝血的患者合并严重感染者，其合用药物的安全性有待进一步研究。用法用量对于沙眼衣原体、泌尿生殖系感染，每日一次，每次口服曲氟沙星 200mg，连续服用5d。对无并发症的淋病，单剂量口服50mg。注重事项妊娠与哺乳期注重事项与氟喹诺酮类药物相同。对曲氟沙星和其它喹诺酮类药物过敏者禁用。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