**左氧氟沙星**

文章版本号：5

最后发布时间：2014-7-14 9:30:45

**【特别警示】**

1.氟喹诺酮类药(包括本药)可增加肌腱炎和肌腱断裂发生的风险，60岁以上老年人、使用糖皮质激素及肾脏、心脏、肺移植的患者，其风险进一步增加。(CFDA药品说明书-甲磺酸左氧氟沙星注射液)

2.氟喹诺酮类药(包括本药)可使重症肌无力患者的肌无力恶化，故有重症肌无力史者避免使用本药。(CFDA药品说明书-甲磺酸左氧氟沙星注射液)

**【药物名称】**

中文通用名称：左氧氟沙星

英文通用名称：Levofloxacin

其他名称：可乐必妥、立佳、左氟沙星、左旋氧氟沙星、Cravit、Levaquin、Levofloxacinum、Quixin。

**【药理分类】**

眼科用药>>眼用抗细菌药

抗感染药>>合成抗菌药>>喹诺酮类

皮肤及皮下用药>>皮肤抗感染药>>皮肤抗细菌药

耳鼻喉科用药

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

用于敏感细菌引起的下列感染：

1.呼吸系统感染：急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作、弥漫性细支气管炎、支气管扩张合并感染、肺炎、扁桃体炎(扁桃体周脓肿)、急性鼻窦炎、社区获得性肺炎、医院获得性肺炎。

2.泌尿系统感染：急性肾盂肾炎、复杂性尿路感染、非复杂性尿路感染。

3.生殖系统感染：前列腺炎、附睾炎、宫腔感染、子宫附件炎、盆腔炎(疑有厌氧菌感染时可合用甲硝唑)。

4.皮肤及软组织感染：脓肿、蜂窝织炎、疖、脓疱病、脓皮病、伤口感染。

5.肠道感染：细菌性痢疾、感染性肠炎、沙门菌属肠炎、伤寒及副伤寒等。

6.五官感染：外耳道炎、中耳炎，细菌性结膜炎、角膜炎、角膜溃疡、泪囊炎等外眼感染。

7.其他感染：乳腺炎、外伤、烧伤及手术后伤口感染、腹腔感染(必要时合用甲硝唑)、胆囊炎、胆管炎、骨与关节感染；败血症、粒细胞减少及免疫功能低下患者的多种感染。吸入性炭疽(暴露后)。

**其他临床应用参考**

用于治疗和预防由鼠疫杆菌引起的鼠疫。(FDA批准适应症)

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·慢性支气管炎急性发作

1.口服给药  一次500mg，一日1次，疗程7日。

2.静脉滴注  参见“口服给药”项。

·急性鼻窦炎

1.口服给药  (1)5日治疗方案：一次750mg，一日1次，疗程5日。(2)10-14日治疗方案：一次500mg，一日1次，疗程10-14日。

2.静脉滴注  参见“口服给药”项。

·社区获得性肺炎

1.口服给药  (1)5日治疗方案：一次750mg，一日1次，疗程5日。(2)7-14日治疗方案：一次500mg，一日1次。

2.静脉滴注  参见“口服给药”项。

·医院获得性肺炎

1.口服给药  一次750mg，一日1次，疗程7-14日。

2.静脉滴注  参见“口服给药”项。

·复杂性尿路感染或急性肾盂肾炎

1.口服给药  (1)5日治疗方案：一次750mg，一日1次，疗程5日。(2)10日治疗方案：一次250mg，一日1次，疗程10日。

2.静脉滴注  参见“口服给药”项。

·非复杂性尿路感染

1.口服给药  一次250mg，一日1次，疗程3日。

2.静脉滴注  参见“口服给药”项。

·慢性前列腺炎

1.口服给药  一次500mg，一日1次，疗程28日。

2.静脉滴注  参见“口服给药”项。

·复杂性皮肤及皮肤软组织感染

1.口服给药  一次750mg，一日1次，疗程7-14日。

2.静脉滴注  参见“口服给药”项。

·非复杂性皮肤及皮肤软组织感染

1.口服给药  一次500mg，一日1次，疗程7-10日。

2.静脉滴注  参见“口服给药”项。

·吸入性炭疽(暴露后)

1.口服给药  一次500mg，一日1次，疗程60日。

2.静脉滴注  参见“口服给药”项。

·脓疱病

1.局部给药  本药软膏，涂檫于患处，一日3次，疗程5日。

·疥疮、毛囊炎和其他化脓性皮肤病

1.局部给药  本药软膏，涂檫于患处，一日1次，疗程7日。

·细菌性结膜炎、细菌性角膜炎

1.经眼给药  (1)滴眼液：一次1-2滴，一日3-5次，细菌性结膜炎疗程7日，细菌性角膜炎疗程9-14日。(2)眼用凝胶：涂于眼下睑穹隆部，一日3次(早、中、晚各1次)。

·外耳道炎、中耳炎

1.经耳给药  本药滴耳液，一次6-10滴，一日2-3次，滴耳后进行约10分钟耳浴，依据症状适当增减滴耳次数，疗程4周。

◆肾功能不全时剂量

1.肌酐清除率(Ccr)大于或等于50ml/min时不需调整剂量。

2.医院获得性肺炎、社区获得性肺炎(5日疗法)、急性鼻窦炎(5日疗法)、复杂性皮肤及皮肤软组织感染、复杂性尿路感染或急性肾盂肾炎(5日疗法)：(1)Ccr为20-49ml/min者，每48小时750mg。(2)Ccr为10-19ml/min者，首剂750mg，随后每48小时500mg。

3.社区获得性肺炎(7-14日疗法)、急性鼻窦炎(10-14日疗法)、慢性支气管炎急性发作、非复杂性皮肤及皮肤软组织感染、慢性前列腺炎、吸入性炭疽(暴露后)：(1)Ccr为20-49ml/min者，首剂500mg，随后每24小时250mg。(2)Ccr为10-19ml/min者，首剂500mg，随后每48小时250mg。

4.复杂性尿路感染或急性肾盂肾炎(10日疗法)、非复杂性尿路感染：(1)Ccr为20-49ml/min者无需调整剂量。(2)Ccr为10-19ml/min者，每48小时250mg；如用于治疗单纯性尿路感染，无需调整剂量。

◆老年人剂量

老年患者常有肾功能减退，因本药主要经肾排出，故需减量应用。高龄患者口服给药时一般采用一次100mg，一日2次的给药方案，并注意给药间隔时间。

◆透析时剂量

血液透析、持续性非卧床腹膜透析(CAPD)患者：(1)用于医院获得性肺炎、社区获得性肺炎(5日疗法)、急性鼻窦炎(5日疗法)、复杂性皮肤及皮肤软组织感染、复杂性尿路感染或急性肾盂肾炎(5日疗法)，首剂750mg，随后每48小时500mg。(2)用于社区获得性肺炎(7-14日疗法)、急性鼻窦炎(10-14日疗法)、慢性支气管炎急性发作、非复杂性皮肤及皮肤软组织感染、慢性前列腺炎、吸入性炭疽(暴露后)，首剂500mg，随后每48小时250mg。

**儿童**

◆常规剂量

·吸入性炭疽(暴露后)

1.口服给药  (1)6个月及以上、体重低于50kg的儿童，一次8mg/kg，一日2次，持续60日，单次最大剂量不超过250mg。(2)6个月及以上、体重大于50kg的儿童同成人用法用量。

2.静脉滴注  参见“口服给药”项。

**【国外用法用量参考】**

除以上国内用法与用量外，还有如下用法用量：

**成人**

◆常规剂量

·急性肾盂肾炎

1.口服给药  (1)常规剂量，一次750mg，一日1次，疗程5日。(2)大肠埃希菌感染患者，一次250mg，每24小时1次，疗程10日。(3)大肠埃希菌感染并发菌血症患者，一次750mg，每24小时1次，疗程5日。

2.静脉给药  (1)大肠埃希菌感染患者，一次250mg，每24小时1次，疗程10日。(2)大肠埃希菌感染并发菌血症患者，一次750mg，每24小时1次，疗程5日。

·复杂性尿路感染

1.口服给药  (1)由粪肠球菌、阴沟肠球菌、大肠埃希菌、肺炎克雷伯菌、奇异变形杆菌、铜绿假单胞菌引起的复杂性尿路感染：一次250mg，每24小时1次，疗程10日。(2)由大肠埃希菌、肺炎克雷伯菌、奇异变形杆菌引起的复杂性尿路感染：也可一次750mg，每24小时1次，连用5日。

2.静脉给药  参见“口服给药”项。

·非淋球菌性尿道炎

1.口服给药  一次500mg，一日1次，疗程7日。

·旅行性腹泻

1.口服给药  一次500mg，一日1次，疗程1-3日。

·细菌性结膜炎

1.经眼给药  本药0.5%滴眼液，第1和2日，患侧一次1-2滴，清醒时每2小时1次，最多一日8次；第3-7日，患侧一次1-2滴，清醒时每4小时1次，最多一日4次。

·角膜溃疡

1.经眼给药  本药1.5%滴眼液，第1-3日，患侧一次1-2滴，清醒时每30-120分钟1次，休息后每4-6小时1次。第4日至治疗结束，患侧一次1-2滴，清醒时每1-4小时1次。

·鼠疫

1.口服给药  一次500mg，每24小时1次，疗程10-14日。

2.静脉给药  参见“口服给药”项。

**儿童**

◆常规剂量

·细菌性结膜炎

1.经眼给药  1岁及1岁以上儿童同成人用法用量。

·角膜溃疡

1.经眼给药  6岁及6岁以上儿童同成人用法用量。

·预防吸入性炭疽(暴露后)

1.口服给药  6个月及6个月以上、体重大于50kg的儿童同成人用法用量；6个月及6个月以上、体重小于50kg的儿童，一次8mg/kg，每12小时1次，疗程60日，单次最大剂量为250mg。

2.静脉给药  参见“口服给药”项。

·鼠疫

1.口服给药  体重大于50kg儿童同成人用法用量；6个月及6个月以上、体重小于50kg儿童，一次8mg/kg(单次最大剂量不超过250mg)，每12小时1次，疗程10-14日。

2.静脉给药  参见“口服给药”项。

**【给药说明】**

**给药方式说明**

1.口服给药  本药分散片可直接吞服，或投入约100ml水中，振摇分散后服用。

2.静脉滴注  本药注射剂剂量为250mg或500mg时，滴注时间不应少于60分钟；剂量为750mg时，滴注时间不应少于90分钟。滴速过快易引起静脉刺激症状或中枢神经系统反应。

3.经眼给药  本药滴眼液仅用于滴眼(滴入眼睑内)，不可用于结膜下注射，也不可直接滴入眼前房内。

4.经耳给药  本药滴耳液仅用于滴耳。

**注射液的配制**

静脉滴注液：(1)本药粉针剂在临用前配制，先用注射用水溶解，再用0.9%氯化钠注射液、5%葡萄糖注射液、5%葡萄糖/0.9%氯化钠注射液、5%葡萄糖乳酸化林格氏液、5%葡萄糖/0.45%氯化钠/0.15%氯化钾注射液和1/6M乳酸钠注射液稀释至5mg/ml后静脉滴注。(2)本药注射液用上述溶液稀释至5mg/ml后静脉滴注。(3)注射液稀释后，在25℃及以下可以保存72小时，在5℃可保存14日，-20℃下可保存6个月。(4)静脉滴注液冻结后可置于25℃或8℃下融解为溶液，勿用微波或水浴加速其融解，融解一次后也不能再反复冻融。

**【禁忌症】**

1.对本药或其他喹诺酮类药过敏者。

2.皮肤有药物过敏史者禁用本药软膏。

3. 18岁以下儿童禁用本药全身制剂[除用于预防吸入性炭疽(暴露后)]。

4.妊娠期妇女禁用本药全身制剂。

5.哺乳期妇女禁用本药全身制剂。

**【慎用】**

1.重度肾功能不全者。

2.中枢神经系统疾病患者。

3.有癫痫史者。

4.类风湿关节炎患者(国外资料)。

5.具有或潜在的QT间期延长患者(国外资料)。

6.肝功能损害者(国外资料)。

7.糖尿病患者(国外资料)。

8.高龄患者。

9.哺乳期妇女慎用本药滴眼液。

**【特殊人群】**

**儿童**

在未成年动物中使用本药可致关节软骨病变，故18岁以下儿童禁用本药全身制剂[除用于预防吸入性炭疽(暴露后)]。

**老人**

老年人使用本药全身制剂不良反应(如肝毒性、肌腱断裂、QT间期改变)可能增加。

**妊娠期妇女**

1.本药可通过胎盘屏障，动物试验虽未证实喹诺酮类药物有致畸作用，但鉴于本药可引起未成年动物关节病变，妊娠期妇女或可能妊娠的妇女禁用本药全身制剂，妊娠期妇女使用本药滴眼液应权衡利弊。

2.美国食品药品管理局(FDA)对本药的妊娠安全性分级为C级。

**哺乳期妇女**

本药可随乳汁排泄，故哺乳期妇女禁用本药全身制剂，慎用本药滴眼液。

**特殊疾病状态**

1.类风湿关节炎患者、重度肾功能不全者：以上患者用药有增加肌腱断裂的风险，故应慎用。

2.葡萄糖-6-磷酸脱氢酶(G6PD)缺乏患者：此类患者使用喹诺酮类药物可能发生溶血性反应。

**【不良反应】**

1.心血管系统  少见心脏停搏、心悸、室性心律不齐。可见QT间期延长、心脏停搏、血管舒张、血管炎。罕见尖端扭转型室性心动过速。

2.代谢/内分泌系统  少见高血糖和高钾血症。偶有低血糖的报道。

3.呼吸系统  常见呼吸困难。少见间质性肺炎、鼻出血。可见嗅觉丧失、嗅觉异常、过敏性肺炎。本药滴眼液最常报道的不良反应为咽炎，发生率1%-3%。

4.肌肉骨骼系统  少见肌痛、骨痛。偶见横纹肌溶解症、跟腱炎、跟腱断裂、关节疼痛。可见肌酶升高。

5.泌尿生殖系统  常见阴道炎。少见急性肾功能不全、急性肾衰竭。偶见血尿素氮升高。也可见血尿、间质性肾炎。高剂量应用时可见结晶尿。

6.神经系统  少见惊厥、感觉错乱、眩晕、高张力状态、运动过度、步态异常、晕厥。偶见震颤、麻木感、嗜睡、耳鸣、视觉异常、倦怠。也可见失眠、头晕、头痛、抽搐、癫痫大发作、谵妄。还可出现颅内压升高(包括假性脑瘤)、周围神经病、重症肌无力恶化、脑病、脑电图(EEG)异常、发声困难。

7.精神  少见焦虑、激动、抑郁、梦魇、睡眠障碍。偶见幻觉、精神紊乱的报道。还可出现意识模糊、中毒性精神病、偏执、自杀行为和自杀想法。

8.肝脏  少见黄疸。也可见一过性肝功能异常(如血清氨基转移酶升高、总胆红素升高等)。还可见肝衰竭、肝炎。

9.胃肠道  常见便秘。少见假膜性结肠炎等伴有血便的重症结肠炎、胃炎、口炎、胰腺炎、食管炎、胃肠炎、舌炎。也可见食欲减退、恶心、呕吐、腹部不适、腹痛、腹胀、腹泻、消化不良、味觉异常、难辨梭菌相关性腹泻(CDAD)。

10.血液  少见溶血性贫血、粒细胞缺乏。也可见贫血、白细胞减少、血小板减少、嗜酸粒细胞增多、紫绀、全血细胞减少、再生障碍性贫血、凝血酶原时间延长。个别患者可有红细胞、血红蛋白、血细胞比容减少等。

11.皮肤  可见皮疹、瘙痒、红斑等。可见光敏或光毒性反应、白细胞破裂性血管炎。偶见荨麻疹。少见中毒性表皮坏死松解症(Lyell综合征)。罕见Stevens-Johnson综合征。

12.眼  本药滴眼液最常报道的不良反应为暂时性视力下降、一过性眼睛灼热、眼痛或不适、畏光，发生率1%-3%；其他发生率低于1%的不良反应有：眼睑水肿、眼干及瘙痒。本药口服制剂和注射剂可引起视觉障碍，包括复视、视觉灵敏度减退、视物模糊、暗点。还可见葡萄膜炎。

13.耳  本药滴耳液偶可引起中耳痛及瘙痒感。本药口服制剂和注射剂可引起听觉减退和耳鸣。

14.过敏反应  偶有过敏性血管炎等的报道。少见光敏反应。也可见血管神经性水肿(包括咽、喉或脸部水肿)、气道阻塞、呼吸困难、荨麻疹、瘙痒。还可见过敏性休克、血清病。

15.其他  常见胸痛。偶见水肿。少见休克。也可见寒战、念珠菌病、多器官衰竭、发热。注射部位可出现发红、发痒或静脉炎等。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.丙磺舒、西咪替丁：

结果：丙磺舒和西咪替丁对本药吸收过程无明显影响，但可使本药曲线下面积(AUC)升高27%-38%，半衰期延长30%，而总清除率及肾清除率降低21%-35%。

处理：上述改变尚不足以调整本药剂量。

2.华法林及其衍生物：

结果：合用可能增强以上药物的作用。

处理：合用时应监测凝血酶原时间或其他凝血试验。

3.环孢素：

结果：合用可使环孢素的血药浓度升高。

处理：合用时必须监测环孢素的血药浓度，并调整剂量。

4.阿洛司琼：

结果：合用可导致阿洛司琼血药浓度升高，出现不良反应的风险增加。

机制：本药可抑制由细胞色素P450(CYP) 1A2调节的药物代谢。

5.茶碱类药：

结果：本药对茶碱类药物体内代谢的影响虽然远较依诺沙星、环丙沙星小，但可能导致茶碱血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等。

机制：CYP结合部位竞争性抑制，导致茶碱类药物肝消除明显减少，血消除半衰期延长。

处理：合用时需监测茶碱血药浓度和调整剂量。

6.苯丙酸、联苯丁酮酸类、非甾体类抗炎药：

结果：合用有引发抽搐的可能。与非甾体类抗炎药合用可导致中枢神经系统兴奋，癫痫发作的风险增加。

处理：应避免合用。

7.决奈达隆、美索达嗪、硫利达嗪、利多卡因、乙酰卡尼、恩卡尼、氟卡尼、托卡尼、普鲁卡因胺、普罗帕酮、胺碘酮、美西律、溴苄胺、丙吡胺、莫雷西嗪、奎尼丁、阿义马林、替地沙米、阿齐利特、多非利特、司美利特、伊布利特、雷诺嗪、索他洛尔、氟康唑、氯丙嗪、奋乃静、氟哌利多、齐拉西酮、伊洛哌酮、美沙酮、舒尼替尼、拉帕替尼、尼洛替尼：

结果：合用可导致QT间期延长、尖端扭转型室性心动过速、心脏停搏等心脏毒性风险增加。

处理：禁止合用。

8.口服降糖药：

结果：合用可能引起血糖失调，包括高血糖或低血糖。

处理：合用时需严密监测血糖浓度，一旦发生低血糖应立即停药，并给予适当处理。

9.含铝、镁药物(如抗酸药、去羟肌苷)及钙、铁、锌剂：

结果：合用可干扰本药口服制剂的胃肠道吸收，使本药在各系统内的浓度明显降低。

处理：服用以上药物应在口服本药前或后至少2小时。

10.尿碱化药：

结果：合用可降低本药在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。

11.地高辛：

结果：合用对两种药物的药代动力学参数无显著影响。

处理：合用时无需调整剂量。

**【注意事项】**

**用药警示**

1.接受本药治疗时，应避免过度阳光曝晒或接触人工紫外线。

2.与其他抗感染药一样，延长使用本药滴眼液、软膏可能导致非敏感微生物的过度生长，包括真菌。因此本药滴眼液、眼用凝胶、软膏不应长期使用。

3.低钾血症或心肌病患者应避免使用本药。

4.本药滴耳液一般适用于中耳炎局限在中耳黏膜部位的局部治疗。若炎症已漫及鼓室周围时，除局部治疗外，应同时服用口服制剂。

5.为避免结晶尿的发生，应多饮水，保持24小时排尿量在1200ml以上。

6.周围神经病变症状可在给药后不久出现，且不可逆。

**不良反应的处理方法**

1.如出现过敏反应、光敏反应或皮肤损伤时应停用本药，并根据临床具体情况而采取以下药物或方法治疗：肾上腺素及其他抢救措施，包括吸氧，静脉输液，给予抗组胺药、皮质类固醇等。

2.如发生跟腱炎或跟腱断裂，须立即停药，严禁运动，直至症状消失。

**药物对检验值或诊断的影响**

本药可导致尿筛查阿片制剂出现假阳性结果。

**用药前后及用药时应当检查或监测**

1.监测全血细胞计数、肝肾功能、血糖、血清电解质。

2.治疗期间应进行细菌培养和药敏试验。

**其他注意事项**

建议细菌性结膜炎、角膜炎患者使用眼用制剂时不配戴角膜接触镜。

**【国外专科用药信息参考】**

**牙科用药信息**

本药可导致QT间期延长，有引起尖端扭转型室性心动过速的风险，牙科操作时应谨慎。

**精神状况信息**

1.对精神状态的影响：本药可能引起兴奋、焦虑、意识模糊、抑郁、头晕、幻觉、失眠、神经质、妄想症和镇静。

2.对精神障碍治疗的影响：(1)本药与氯氮平和卡马西平合用应谨慎，因可能引起白细胞减少。(2)本药与氯氮平及其他抗精神病药合用应谨慎，因可能抑制CYP 1A2。

**护理注意事项**

1.体质评估/监测：应监测超敏反应、机会性感染、肌腱断裂或持续性腹泻情况。

2.实验室检查：(1)开始给药前应进行细菌培养和药敏试验。(2)治疗期间应定期监测白细胞计数、评价器官(肝、肾、造血系统)功能。

**【药物过量】**

**过量的表现**

喹诺酮类药物过量可出现恶心、呕吐、胃痛、胃灼热、腹泻、口渴、口腔炎、蹒跚、头晕、头痛、全身倦怠、麻木感、发冷、发热、锥体外系症状、兴奋、幻觉、抽搐、谵妄、共济失调、颅内压升高(头痛、呕吐、视神经盘水肿)、代谢性酸中毒、血糖升高、丙氨酸氨基转移酶升高、天门冬氨酸氨基转移酶升高、碱性磷酸酶升高、白细胞减少、嗜酸粒细胞增多、血小板减少、溶血性贫血、血尿、软骨或关节障碍、白内障、视力障碍、色觉异常及复视。

**过量的处理**

1.洗胃。

2.给予吸附药：活性炭(40-60g加水200ml口服)。

3.给予泻药：硫酸镁(30g加水200ml)或其他缓泻药。

4.输液(加保肝药物)。

5.强制利尿：给予呋塞米注射液。

6.对症疗法：抽搐时应反复给予地西泮静脉注射液。

7.重症患者：可考虑进行血液透析。

**【药理】**

**药效学**

本药为氧氟沙星的左旋体，其抗菌活性约为氧氟沙星的2倍。

◆作用机制  本药的主要作用机制为抑制细菌DNA旋转酶(细菌拓扑异构酶Ⅱ)的活性，阻碍细菌DNA的复制。

◆抗菌谱  本药具有抗菌谱广、抗菌作用强的特点，对大多数肠杆菌科细菌，如大肠埃希菌、克雷白菌属、沙雷氏菌属、变形杆菌属、志贺菌属、沙门氏菌属、枸缘酸杆菌、不动杆菌属以及铜绿假单胞菌、流感嗜血杆菌、淋球菌等革兰氏阴性细菌有较强的抗菌活性。对部分甲氧西林敏感葡萄球菌、肺炎链球菌、化脓性链球菌、溶血性链球菌等革兰阳性菌和军团菌、支原体、衣原体也有良好的抗菌作用，但对厌氧菌和肠球菌的作用较差。

**药动学**

国外资料报道，单次静脉注射本药300mg和相同剂量口服给药的药动学参数相似，见下表：

|  |  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- | --- |
| 左氧氟沙星300mg静脉注射(n=8)和口服(n=12)后药代动力学参数的平均值 | | | | |
| 给药途径 | Cmax(μg/ml) | AUC(μg·h)/ml | T1/2(h) | 肾清除率(ml/min) |
| 静脉注射 | 6.27 | 20.73(AUC0-24) | 6.28 | 145.55 |
| 口服给药 | 4.04 | 22.62(AUC0-48) | 6.48 | 162.80 |

多剂量研究中(300mg一日2次静脉滴注，共6日)其血药浓度于24-48小时达稳态。首次及末次剂量后的血药峰浓度分别为5.35μg/ml和6.12μg/ml，表明无明显蓄积。本药在体内组织中分布广泛。主要以原形药由尿中排泄，口服给药后48小时内，尿中原形药排出量约占给药量的87%；72小时内粪便中的排出药量少于给药量的4%；约5%的药物以无活性代谢物形式由尿中排泄。肾功能减退者清除率下降，消除半衰期延长，为避免药物蓄积，应进行剂量调整。血液透析和CAPD不影响本药从体内排除。

给予本药滴眼液后，60分钟内平均泪液浓度为34.9-221.1μg/ml，滴眼后4小时和6小时的平均泪液浓度分别为17μg/ml和6.6μg/ml。

**遗传、生殖毒性与致癌性**

◆遗传毒性  本药Ames试验、CH0/HGPRT突变试验、小鼠微核试验、大鼠程序外DNA合成试验(UDS)、小鼠体内姐妹染色体交换试验结果均为阴性。体外CHL细胞株染色体畸变试验、CHL/IU细胞株姐妹染色体交换试验结果均为阳性。

◆生殖毒性  大鼠妊娠前、妊娠早期、围产期、授乳期经口给药剂量达360mg/kg时，均未见对雌雄动物的生殖能力、胎仔的影响，对分娩、新生幼仔、授乳未见明显影响。器官形成期大鼠给药(剂量达90mg/kg)时，对胎仔和新生幼仔均未见明显影响。家兔经口给药50mg/kg时，未出现胚胎、胎仔的致死作用以及迟缓胎儿生长的作用，也未出现致畸作用。

◆致癌性  大鼠掺食法给予本药最大日剂量为100mg/kg，连用2年，未发现致癌性。

**【制剂与规格】**

左氧氟沙星片  (1)100mg。(2)200mg。(3)500mg。

甲磺酸左氧氟沙星片(以左氧氟沙星计)  100mg。

盐酸左氧氟沙星片(以左氧氟沙星计)  (1)100mg。(2)200mg。(3)250mg。(4)500mg。

乳酸左氧氟沙星片(以左氧氟沙星计)  (1)100mg。(2)200mg。(3)500mg。

盐酸左氧氟沙星分散片(以左氧氟沙星计)  100mg。

乳酸左氧氟沙星分散片(以左氧氟沙星计)  (1)100mg。(2)200mg。

左氧氟沙星胶囊  (1)100mg。(2)200mg。

甲磺酸左氧氟沙星胶囊(以左氧氟沙星计)  100mg。

乳酸左氧氟沙星胶囊(以左氧氟沙星计)  100mg。

盐酸左氧氟沙星胶囊(以左氧氟沙星计)  (1)100mg。(2)200mg。(3)250mg。

左氧氟沙星注射液  (1)2ml:200mg。(2)5ml:300mg。(3)5ml:500mg。(4)10ml:500mg。

左氧氟沙星氯化钠注射液  (1)50ml(左氧氟沙星100mg、氯化钠0.475g)。(2)100ml(左氧氟沙星300mg、氯化钠0.95g)。(3)100ml(左氧氟沙星500mg、氯化钠0.9g)。

乳酸左氧氟沙星注射液(以左氧氟沙星计)  (1)2ml:100mg。(2)2ml:200mg。(3)5ml:500mg。(4)100ml:100mg。(5)100ml:200mg。(6)100ml:300mg。(7)100ml:500mg。(8)200ml:200mg。(9)250ml:500mg。

乳酸左氧氟沙星氯化钠注射液  (1)100ml(左氧氟沙星100mg、氯化钠0.9g)。(2)100ml(左氧氟沙星200g、氯化钠0.9g)。(3)100ml(左氧氟沙星300g、氯化钠0.9g)。(4)100ml(左氧氟沙星400mg、氯化钠0.9g)。(5)100ml(左氧氟沙星500mg、氯化钠0.9g)。(6)200ml(左氧氟沙星200mg、氯化钠1.8g)。(7)250ml(左氧氟沙星500mg、氯化钠2.25g)。

乳酸左氧氟沙星葡萄糖注射液  (1)100ml(左氧氟沙星100mg、葡萄糖5g)。(2)100ml(左氧氟沙星200mg、葡萄糖5g)。(3)100ml(左氧氟沙星300mg、葡萄糖5g)。(4)250ml(左氧氟沙星500mg、葡萄糖12.5g)。

甲磺酸左氧氟沙星注射液(以左氧氟沙星计)  (1)2ml:100mg。(2)2ml:200mg。(3)2ml:300mg。

甲磺酸左氧氟沙星氯化钠注射液  (1)100ml(左氧氟沙星300mg、氯化钠0.9g)。(2)250ml(左氧氟沙星500mg、氯化钠2.25g)。

盐酸左氧氟沙星注射液(以左氧氟沙星计)  (1)1ml:100mg。(2)2ml:50mg。(3)2ml:100mg。(4)2ml:200mg。(5)3ml:300mg。(6)5ml:100mg。(7)5ml:200mg。(8)5ml:300mg。(9)5ml:400mg。(10)5ml:500mg。(11)10ml:100mg。(12)10ml:300mg。(13)100ml:100mg。(14)100ml:200mg。(15)100ml:300mg。(16)200ml:200mg。

盐酸左氧氟沙星氯化钠注射液  (1)50ml(左氧氟沙星200mg、氯化钠0.45g)。(2)100ml(左氧氟沙星100mg、氯化钠0.86g)。(3)100ml(左氧氟沙星100mg、氯化钠0.89g)。(4)100ml(左氧氟沙星100mg、氯化钠0.9g)。(5)100ml(左氧氟沙星200mg、氯化钠0.9g)。(6)100ml(左氧氟沙星250mg、氯化钠0.9g)。(7)100ml(左氧氟沙星300mg、氯化钠0.9g)。(8)100ml(左氧氟沙星400mg、氯化钠0.9g)。(9)100ml(左氧氟沙星500mg、氯化钠0.9g)。(10)200ml(左氧氟沙星200mg、氯化钠1.8g)。(11)200ml(左氧氟沙星300mg、氯化钠1.8g)。

盐酸左氧氟沙星葡萄糖注射液  (1)100ml(左氧氟沙星100mg、葡萄糖5g)。(2)100ml(左氧氟沙星300mg、葡萄糖5g)。

注射用左氧氟沙星  (1)200mg。(2)300mg。(3)500mg。

注射用盐酸左氧氟沙星(以左氧氟沙星计)  (1)100mg。(2)200mg。(3)300mg。(4)400mg。

注射用乳酸左氧氟沙星(以左氧氟沙星计)  (1)100mg。(2)200mg。(3)250mg。(4)300mg。(5)500mg。

注射用甲磺酸左氧氟沙星(以左氧氟沙星计)  (1)100mg。(2)200mg。(3)300mg。(4)400mg。(5)500mg。

盐酸左氧氟沙星软膏  0.3%。

左氧氟沙星滴眼液  5ml:24.4mg。

乳酸左氧氟沙星滴眼液(以左氧氟沙星计)  (1)5ml:15mg。(2)8ml:24mg。

盐酸左氧氟沙星滴眼液(以左氧氟沙星计)  (1)5ml:15mg。(2)7ml:21mg。(3)8ml:24mg。

盐酸左氧氟沙星眼用凝胶(以左氧氟沙星计)  5g:15mg。

盐酸左氧氟沙星滴耳液  0.5%。

**【贮藏】**

片剂：遮光，密封保存。

分散片：遮光，密封(10-30℃)保存。

胶囊：遮光，密封保存。

注射液：遮光，密封，阴凉(不超过20℃)干燥处保存。

粉针剂：遮光，密封保存。

软膏：遮光，密封，阴凉(不超过20℃)处保存。

滴眼液：遮光，密封，阴凉(不超过20℃)处保存。

眼用凝胶：遮光，密封，凉暗处保存。

滴耳液：遮光，密封保存。

使用UpToDate临床顾问须遵循[用户协议](http://www.uptodate.com/contents/license)。

专题 94010 版本 1.0