**氧氟沙星**

文章版本号：3

最后发布时间：2014-4-15 9:45:56

**【特别警示】**

1.喹诺酮类药物可增加肌腱炎和肌腱断裂的风险，60岁以上老人、使用类固醇药物及肾脏、心脏、肺移植的患者，其风险进一步增加。(FDA药品说明书-氧氟沙星片)

2.喹诺酮类药物可能会加重重症肌无力患者的肌无力，故有重症肌无力史者避免使用本药。(FDA药品说明书-氧氟沙星片)

**【药物名称】**

中文通用名称：氧氟沙星

英文通用名称：Ofloxacin

其他名称：安福乐、安利、昂迪尔、奥迪扶康、奥复星、奥卫特、贝立德、迪可罗、东康明、噁嗪氟哌酸、菲宁达、氟嗪酸、复尔必妥、盖洛仙、浩特、恒润、捷孚、晶奇、康泰必妥、诺青、瑞达、泰福康、泰利必妥、泰利得、信利妥、延华星、阳达宁、氧洛沙星、氧威、优利克、赞诺欣、正康、竹安新、Exocin、Exocine、Floxal、Floxin、Inlflox、Ocuflox、Oflocet、Oflocin、Oflox、Ofloxacinum、Oxaldin、Tarivad、Tarivid、Trafloxal、Unguentum Ofloxacini、Zanocin。

**【药理分类】**

女性生殖系统用药>>其它女性生殖系统药

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

眼科用药>>眼用抗细菌药

抗感染药>>合成抗菌药>>喹诺酮类

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

用于敏感菌所致的下列感染：

1.泌尿生殖系统感染，包括单纯性及复杂性尿路感染、细菌性前列腺炎、淋球菌尿道炎或宫颈炎(包括产酶株所致者)等。

2.呼吸系统感染，包括慢性支气管炎急性发作及肺部感染等。

3.胃肠道感染。

4.伤寒。

5.骨、关节、皮肤软组织感染及败血症。

6.本药滴耳液可用于中耳炎、外耳道炎、鼓膜炎。

7.本药滴眼液和眼膏可用于细菌性结膜炎、细菌性角膜炎、角膜溃疡、泪囊炎、术后感染等外眼感染。

8.本药栓剂和阴道泡腾片可用于细菌性阴道病。

9.本药乳膏、软膏和凝胶可用于脓疱疮、疥疮、毛囊炎、湿疹合并感染、外伤感染、癣病合并感染及其他化脓性皮肤感染。

**其他临床应用参考**

1.作为抗结核病的二线药物，多与异烟肼、利福平等合用。

2.用于旅行者腹泻。

3.用于麻风病。

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·支气管感染、肺部感染

1.口服给药  一次300mg，一日2次，疗程7-14日。

2.静脉滴注  一次300mg，一日2次，缓慢滴注，疗程7-14日。

·急性单纯性下尿路感染

1.口服给药  (1)普通片、胶囊：一次200mg，一日2次，疗程5-7日。(2)缓释片：一次400mg，一日1次，疗程根据患者的病情酌情使用，建议3-7日。

2.静脉滴注  一次200mg，一日2次，缓慢滴注，疗程5-7日。

·复杂性尿路感染

1.口服给药  (1)普通片、胶囊：一次200mg，一日2次，疗程10-14日。(2)缓释片：一次400mg，一日1次，疗程10日。

2.静脉滴注  一次200mg，一日2次，缓慢滴注，疗程10-14日。

·细菌性前列腺炎

1.口服给药  一次300mg，一日2次，疗程6周。

2.静脉滴注  一次300mg，一日2次，缓慢滴注，疗程6周。

·衣原体宫颈炎或尿道炎

1.口服给药  一次300mg，一日2次，疗程7-14日。

2.静脉滴注  一次300mg，一日2次，缓慢滴注，疗程7-14日。

·单纯性淋病

1.口服给药  一次400mg，顿服。

2.静脉滴注  一次400mg，缓慢滴注。

·伤寒

1.口服给药  一次300mg，一日2次，疗程10-14日；为控制伤寒反复感染时，一日50mg，连用3-6月。

2.静脉滴注  一次300mg，一日2次，缓慢滴注，疗程10-14日。

·铜绿假单胞菌感染或重度感染

1.口服给药  一次400mg，一日2次。

2.静脉滴注  一次400mg，一日2次，缓慢滴注。

·中耳炎、外耳道炎、鼓膜炎

1.经耳给药  本药滴耳液，患侧一次6-10滴，一日2-3次，滴耳后应进行10分钟的耳浴。根据症状适当增减滴耳次数。

·细菌性结膜炎、细菌性角膜炎、角膜溃疡、泪囊炎、术后感染等外眼感染

1.经眼给药  (1)滴眼液：滴于眼睑内，一次1-2滴，一日3-5次。(2)眼膏：取适量涂于眼睑内，一日3次。

·细菌性阴道病

1.阴道给药  (1)本药栓剂：清洁外阴后，取仰卧位，垫高臀部，将栓剂送入阴道深部，保留5-10分钟。每日早、晚各1次，一次100mg。(2)本药阴道泡腾片：一次100mg，每晚1次。临用前清洗外阴，将药片置于阴道深部，连用7日。

·脓疱疮、疥疮、毛囊炎、湿疹合并感染、外伤感染、癣病合并感染及其他化脓性皮肤感染

1.局部给药  涂患处，一日2-3次。脓性分泌物多者，先用生理盐水清洁患处后再使用本药。

·抗结核

1.口服给药  一日300mg，顿服。

◆肾功能不全时剂量

肾功能减退者，需根据肾功能调整给药剂量。血清肌酐清除率大于50ml/min，可按常规剂量，每12小时给药1次；血清肌酐清除率为10-50ml/min，按常规剂量一日给药1次；血清肌酐清除率小于10ml/min，按常规剂量的50%，一日给药1次。

◆肝功能不全时剂量

肝功能减退者应调整剂量。重度肝功能不全时(肝硬化腹水等)，药物清除减少，血药浓度增高，肝、肾功能均减退者尤为明显，用药时应注意调整剂量。每日最大剂量不得超过400mg。

◆老年人剂量

老年患者多有肾功能减退，应减量给药。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·非复杂性膀胱炎

1.口服给药  (1)大肠埃希菌或肺炎克雷伯杆菌引起者，一次200mg，每12小时1次，疗程3日。(2)其他敏感细菌引起者，一次200mg，每12小时1次，疗程7日。

·非淋菌性尿道炎

1.口服给药  一次300mg，一日2次，疗程7日。

·前列腺炎

1.口服给药  一次300mg，每12小时1次，疗程6周。

·复杂性泌尿系统感染

1.口服给药  一次200mg，每12小时1次，疗程10日。

·衣原体感染

1.口服给药  一次300mg，每12小时1次，疗程7日。

·慢性支气管炎急性细菌感染、社区获得性肺炎、皮肤和(或)皮下组织感染

1.口服给药  一次400mg，每12小时1次，疗程10日。

·外耳炎

1.经耳给药  一次10滴，滴入感染耳，一日1次，疗程7日。

·慢性化脓性中耳炎鼓膜穿孔

1.经耳给药  一次10滴，滴入感染耳，一日2次，疗程14日。

·细菌性结膜炎

1.经眼给药  第1-2日，一次1-2滴，滴入感染眼，每2-4小时1次。第3-7日，一次1-2滴，一日4次。

·角膜溃疡

1.经眼给药  第1-2日，一次1-2滴，滴入感染眼，清醒时，每30分钟1次。第3-7日，一次1-2滴，清醒时每小时1次，正常睡眠时每4-6小时1次。第7-9日，一次1-2滴，一日4次。

·旅行者腹泻

1.口服给药  一次300mg，一日2次，疗程1-3日。

◆肾功能不全时剂量

肾功能不全时应调整剂量。当肌酐清除率为20-50ml/min时，使用常用推荐剂量，给药间隔为每24小时1次；当肌酐清除率小于20ml/min时，使用常用推荐剂量一半的剂量，给药间隔为每24小时1次。

◆肝功能不全时剂量

严重肝功能不全(如肝硬化伴或不伴腹水)者，一日剂量不得超过400mg。

◆透析时剂量

有研究者建议透析当日应给予维持剂量100mg，持续性非卧床腹膜透析患者无需补充剂量。

**儿童**

◆常规剂量

·外耳炎

1.经耳给药  (1)6个月至13岁儿童，一次5滴，滴入感染耳，一日1次，疗程7日。(2)13岁及13岁以上青少年，一次10滴，滴入感染耳，一日1次，疗程7日。

·急性中耳炎鼓膜穿孔

1.经耳给药  1-12岁儿童，一次5滴，滴入感染耳，一日2次，疗程10日。

·慢性化脓性中耳炎鼓膜穿孔

1.经耳给药  12岁及12岁以上青少年，一次10滴，滴入感染耳，一日2次，疗程14日。

·细菌性结膜炎

1.经眼给药  1岁及1岁以上儿童，第1-2日，一次1-2滴，滴入感染眼，每2-4小时1次。第3-7日，一次1-2滴，一日4次。

·角膜溃疡

1.经眼给药  1岁及1岁以上儿童，第1-2日，一次1-2滴，滴入感染眼，清醒时每30分钟1次，正常睡眠时每4-6小时1次。第3-7日，一次1-2滴，清醒时每小时1次。第7-9日，一次1-2滴，一日4次。

◆透析时剂量

有研究者建议透析当日应给予维持剂量100mg，持续性非卧床腹膜透析患者无需补充剂量。

**【给药说明】**

**给药方式说明**

1.静脉给药  本药注射剂仅用于缓慢静脉滴注，每200mg静滴时间不得少于30分钟。

2.经眼给药  本药滴眼液只限于滴眼用，不能用于结膜下注射，也不可直接滴入前房内。

**【禁忌症】**

1.对本药及氟喹诺酮类药过敏者。

2.妊娠期妇女。

**【慎用】**

1.严重肾功能不全者。

2.肝损伤患者(国外资料)。

3.类风湿关节炎患者(可能增加肌腱断裂风险)(国外资料)。

**【特殊人群】**

**儿童**

本药用于数种幼龄动物时，可致关节病变。18岁以下患者用药的安全性尚未确立，不宜使用。如细菌仅对氟喹诺酮类药敏感，应在权衡利弊后慎用。

**老人**

老年患者用药后发生不良反应(如肌腱断裂、QT间期改变)的风险增加。

**妊娠期妇女**

1.本药可通过胎盘屏障。动物实验未证实喹诺酮类药物有致畸作用，但妊娠期妇女用药的安全性尚未确定。鉴于本药可引起幼龄动物关节病变，妊娠期妇女禁用。

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，哺乳期妇女全身用药时，应暂停哺乳。

**特殊疾病状态**

1.梅毒患者：本药对治疗梅毒无效，并可能掩盖症状，所有患者应在淋病诊断以及诊断后3个月进行梅毒测试。

2.葡萄糖-6-磷酸酶缺乏者：此类患者用药可能发生溶血。

3.原有中枢神经系统疾病(如癫痫病史)者：此类患者应避免使用本药，确有指征时需权衡利弊后使用。

4.糖尿病患者：氟喹诺酮类药可影响此类患者的血糖控制水平。

**【不良反应】**

本药不良反应发生率在常用的同类药物中相对较低。

1.肌肉骨骼系统  偶见关节疼痛、肌肉痛、跟腱炎、跟腱断裂等。使用氟喹诺酮类药可能出现重症肌无力加重。

2.泌尿生殖系统  可有血尿素氮升高、肌酸酐值升高，也有间质性肾炎(表现为血尿、发热、皮疹等)的报道。高剂量用药时可出现结晶尿。部分患者用药后出现外阴瘙痒、阴道分泌物增多。

3.神经系统  可有头晕、头痛、嗜睡、失眠、眩晕，偶有癫痫发作、震颤。使用氟喹诺酮类药可能出现周围神经病。

4.精神  偶有精神异常、烦躁不安、意识模糊、幻觉。长期大剂量应用可引起轻微精神障碍。还有使用喹诺酮类药物后出现欣快、抑郁、恐慌及妄想的报道。

5.肝脏  偶有血清氨基转移酶升高。

6.胃肠道  可有口干、食欲减退、腹部不适、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、便秘等。还可见味觉异常。

7.血液  可有周围白细胞减少、血小板减少。

8.皮肤  可有皮疹、瘙痒等，光敏反应少见。偶有渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。

9.其他  注射部位可有轻度一过性刺激症状，偶有静脉炎的报道。经耳给药后，偶有中耳疼痛及瘙痒感。经眼给药后，偶有一过性眼灼热、眼痛、不适、咽炎及畏光，罕见过敏、眼睑水肿、眼干燥及瘙痒。软膏局部涂抹后，偶有轻微刺激感。使用栓剂可出现局部不适及过敏。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.丙磺舒：

结果：合用时可因本药血药浓度升高而产生毒性。

机制：丙磺舒可减少本药自肾小管分泌约50%。

2.尿碱化剂：

结果：尿碱化剂可减低本药在尿中的溶解度，导致结晶尿及肾毒性。

3.茶碱类药物：

结果：合用可出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等。

机制：本药对细胞色素P450(CYP)结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类药物的肝清除减少，半衰期延长，血药浓度升高。

处理：本药与诺氟沙星、依诺沙星、环丙沙星等比较，对茶碱的代谢影响虽较小，但合用时仍应监测茶碱类药物血药浓度并调整剂量。

4.环孢素：

结果：合用可使环孢素的血药浓度升高。

处理：合用时应监测环孢素血药浓度，并调整剂量。

5.咖啡因：

结果：本药可使咖啡因清除减少，半衰期延长，并可产生中枢神经系统毒性。但与诺氟沙星、依诺沙星、环丙沙星等比较，本药对咖啡因的代谢影响较小。

6.抗凝药(华法林等)：

结果：合用对抗凝药的抗凝作用增强较小。

处理：合用时应监测患者的凝血酶原时间。

7.降压药、巴比妥类麻醉药：

结果：本药注射液与以上药物合用，可引起血压突然下降。

8.苯酮酸类药物(芬布芬等)、丙酸类解热镇痛药：

结果：合用偶有引起痉挛的报道。

9.含铝、镁离子的抗酸药或铁剂：

结果：合用可使本药疗效减弱。

机制：以上药物可降低本药的吸收。

处理：不宜合用。

**【注意事项】**

**用药警示**

1.应用本药时应避免过度暴露于阳光下。

2.细菌性结膜炎、角膜炎患者用药期间不宜戴角膜接触镜。

3.本药大剂量应用或尿pH值在7以上时可发生结晶尿。为避免结晶尿的发生，宜多饮水，保持24小时排尿量在1200ml以上。

4.本药滴耳液如药温过低，可致眩晕，故应使其温度接近体温。且本药滴耳液适用外耳道炎、中耳炎、鼓膜炎，若炎症已漫及鼓室周围时，除局部治疗外，应同时全身用药。

5.本药长期局部应用时，可能导致非感染微生物的过度生长(如真菌)，不宜长期使用。

**不良反应的处理方法**

如发生光敏反应或其他过敏反应，应立即停药。

**用药前后及用药时应当检查或监测**

大肠埃希菌对氟喹诺酮类药物耐药者多见，应在用药前留取尿培养标本，参考细菌药敏试验结果调整用药。

**【国外专科用药信息参考】**

**牙科用药信息**

与牙科治疗相关的主要不良反应：口干症(停药后唾液分泌恢复正常)和味觉异常。

**精神状况信息**

1.对精神状态的影响：用药后可能引起嗜睡、头晕、神经质或失眠。有使用喹诺酮类药物引起不安、幻觉、欣快、抑郁、恐慌及妄想的报道。

2.对精神障碍治疗的影响：本药可抑制CYP 1A2同工酶，与氯氮平和其他抗精神病药物合用应谨慎，并应监测不良反应。

**护理注意事项**

1.开始治疗前应评估患者细菌培养和药敏试验结果，并应评估有无过敏史。

2.监测患者有无过敏反应(瘙痒、荨麻疹、呼吸困难、面部水肿、意识丧失、刺痛、心血管性虚脱)、机会性感染、肌腱断裂及持续性腹泻等症状。

3.实验室检查：长期用药时应定期监测全血细胞计数、肾功能、肝功能。

**【药物过量】**

**过量的处理**

对于急性药物过量的患者，应密切观察并给予支持疗法，并持续补液，血液透析或腹膜透析只能清除少量本药(＜10%)。

**【药理】**

**药效学**

◆作用机制  本药为第三代喹诺酮类抗菌药，作用机制同环丙沙星，通过作用于细菌DNA旋转酶A亚单位，抑制细菌DNA合成及复制，而致细菌死亡。在体外抗菌活性方面，对革兰阳性菌优于诺氟沙星，对嗜麦芽假单胞菌、恶臭假单胞菌、无硝不动杆菌比诺氟沙星强4-16倍；对支原体的作用与四环素相似；在革兰阴性菌中，对肠杆菌属的抗菌活性与环丙沙星相似或稍高，对其他非发酵革兰阴性菌的作用比诺氟沙星及庆大霉素强，但对铜绿假单胞菌的抗菌活性仅为诺氟沙星的1/2。细菌耐药性的产生与DNA旋转酶A亚单位的结构突变(高度耐药)和细菌细胞膜通透性改变(低度耐药)有关。

◆抗菌谱  本药具有广谱抗菌活性，对肠杆菌属(大肠埃希菌、枸橼酸杆菌、阴沟杆菌、产气杆菌等)、克雷伯菌属、变形杆菌、沙门菌属、志贺菌属、淋病奈瑟菌、葡萄球菌、流感嗜血杆菌、不动杆菌、螺旋杆菌、弧菌属、耶尔森菌、莫拉菌属具有良好抗菌活性。对铜绿假单胞菌、分枝杆菌、肺炎链球菌、溶血性链球菌及粪肠球菌具有抗菌活性。对沙眼衣原体、支原体、军团菌敏感，对厌氧菌的抗菌活性较差。

**药动学**

本药口服吸收迅速且完全。口服200mg、300mg和400mg后，1小时左右达血药峰浓度，分别为2.47mg/L、4.37mg/L和5.60mg/L，多次给药后约3日达稳态血药浓度。生物利用度为95%-100%，进食可轻微影响其吸收。本药吸收后在体内广泛分布，在全身各组织及体液中均可达到有效抗菌浓度。胆汁中药物浓度可达血药浓度的4-8倍；在肺、肾组织中也可达3倍以上；骨、前列腺、皮肤软组织或体液中均可超过血药浓度；在脑脊液中浓度高，脑膜无炎症时可达血药浓度的30%-50%，有炎症时可达70%-90%。蛋白结合率为20%-25%。少量(3%)在肝内代谢，口服24小时内从尿液中排出给药量的75%-90%(主要为原形药物，代谢物很少)，可有少量药物以原形自粪便排出，其24小时和48小时内累积排出量分别为给药量的1.6%和3.9%。本药可通过胎盘屏障，也可经乳汁分泌。消除半衰期为4.7-7小时。

**【制剂与规格】**

氧氟沙星片  (1)100mg。(2)200mg。

氧氟沙星缓释片  400mg。

氧氟沙星胶囊  100mg。

氧氟沙星颗粒  100mg。

氧氟沙星注射液  (1)2ml:100mg。(2)2ml:200mg。(3)5ml:200mg。(4)10ml:200mg。(5)100ml:200mg。(6)100ml:400mg。(7)200ml:400mg。

氧氟沙星氯化钠注射液  100ml(氧氟沙星200mg、氯化钠900mg)。

注射用氧氟沙星  (1)200mg。(2)300mg。(3)400mg。

氧氟沙星滴耳液  (1)5ml:15mg。(2)8ml:24mg。

氧氟沙星滴眼液  (1)0.8ml:8mg。(2)5ml:15mg。(3)8ml:24mg。

氧氟沙星眼膏  (1)0.25g:0.75mg。(2)2g:6mg。(3)3.5g:10.5mg。

氧氟沙星栓  100mg。

氧氟沙星软膏  10g:30mg。

氧氟沙星凝胶  (1)10g:50mg。(2)20g:100mg。

氧氟沙星葡萄糖注射液  (1)100ml(氧氟沙星200mg、葡萄糖5g)。(2)200ml(氧氟沙星200mg、葡萄糖11g)。(3)250ml(氧氟沙星200mg、葡萄糖5g)。(4)250ml(氧氟沙星200mg、葡萄糖5g)。

氧氟沙星乳膏  (1)10g:30mg。(2)20g:60mg。

氧氟沙星阴道泡腾片  100mg。

**【贮藏】**

片剂：遮光，密封保存。

缓释片：遮光、密封，干燥处保存。

胶囊：遮光，密封保存。

颗粒：遮光，密封保存。

注射液：遮光，密封保存。

粉针剂：遮光，密封保存。

滴耳液：遮光，密封保存。

滴眼液：遮光，密封保存。

眼膏：遮光，密封保存。

栓剂：遮光，密封，30℃以下保存。

软膏：密封，阴凉处保存。

凝胶：遮光，密封保存。

乳膏：遮光，密封，阴凉处(不超过20℃)保存。

阴道泡腾片：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 92263 版本 1.0