

# 左氧氟沙星注射液

- **【药品名称】**

通用名称：左氧氟沙星注射液

拼音名称：Zuoyangfeishaxing Zhusheye

- **【成份】** 盐酸左氧氟沙星。化学名称：：(S)-(-)-9-氟-2,3-二氢-3-甲基-10-(4-甲基-1-哌嗪基)-7-氧-7H-吡啶并[1, 2, 3-de]-[1, 4]-苯并恶嗪-6-羧酸盐的一水合物。

- **【性状】** 本品为淡黄绿色的澄明液体。

- **【适应症】** 本品适用于敏感细菌所引起的下列中、重度感染：**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）；**泌尿系统感染**：肾盂肾炎、复杂性尿路感染等；**生殖系统感染**：急性前列腺炎、急性副睾炎、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）；**皮肤软组织感染**：传染性脓疱病、蜂窝组织炎、淋巴管（结）炎、皮下脓肿、肛周脓肿等；**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；**败血症、粒细胞减少及免疫功能低下患者的各种感染**；**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、骨与关节感染以及五官科感染等。

- **【用法用量】** 静脉滴注，成人每日4支，分2次静滴。重度感染患者及病原菌对本品敏感性较差者（如绿脓杆菌），每日最大剂量可增至6支，分2次静滴。（每次加入5%葡萄糖注射液或0.9%氯化钠注射液中稀释后静脉滴注。）据感染的种类及症状可适当增减。

- **【不良反应】** 用药期间可能出现恶心、呕吐、腹部不适、腹泻、食欲不振、腹痛、腹胀等消化症状；失眠、头晕、头痛等神经系统症状；皮疹、瘙痒、红斑及注射部位发红、发痒或静脉炎等症状。亦可出现一过性肝功能异常，如血转氨酶增高、血清总胆红素增加等。上述不良反应发生率在0.1~5%之间。偶见血中尿素氮上升、倦怠、发热、心悸、味觉异常及注射后血管痛等，一般均能耐受，疗程结束后迅速消失。

- **【禁忌】** 对喹诺酮类药物过敏者、妊娠及哺乳期妇女、18岁以下患者禁用。

- **【注意事项】** 1.本制剂专供静脉滴注，滴注时间为每100ml至少60分钟。本制剂不宜与其他药物同瓶混合静滴，或在同一根静脉输液管内进行静滴。 2.肾功能减退者应减量或慎用。肌酐清除率：50~80ml/min 正常剂量20~49ml/min 首剂400mg，以后每24小时200mg；10~49ml/min 首剂400mg，以后每48小时200mg。 3.有中枢神经系统疾病及癫痫病史患者应慎用。 4.喹诺酮类药物尚可引起少见的光毒性反应（发生率<0.1%）。在接受本品治疗时应避免过度阳光曝晒和人工紫外线。如出现光敏反应或皮肤损伤时应停用本品。此外偶有用药后发生跟腱炎或跟腱断裂的报告，故如有上述症状发生时须立即停药并休息，严禁运动，直到症状消失。

- **【孕妇及哺乳期妇女用药】** 1.因不能确保妊娠妇女的用药安全，妊娠或有可能妊娠的妇女禁用。2.因药物经乳汁排泄，所以哺乳期妇女禁用。如必须服用本药，应暂停哺乳。

- **【儿童用药】** 对小儿的安全性尚未确立，故不可用于儿童。

- **【老年用药】** 本品主要经肾脏排泄（参见“药代动力学”），因高龄患者大多肾功能低下，可能会出现持续高血药浓度。因此，应注意用药剂量慎重给药。

- **【药物相互作用】** 本品不能与多价金属离子如镁、钙等溶液在同一输液管中使用。避免与茶碱同时使用。如需同时应用，应监测茶碱的血药浓度，据以调整剂量。与华法令或其衍生物同时应用时，应监测凝血酶原时间或其他凝血试验。与非甾体类消炎药物同时应用，有引发抽搐的可能。与口服降血糖药同时使用时可能引起低血糖，因此用药过程中应注意监测血糖浓度，一旦发生低血糖时应立即停用本品，并给予适当处理。

- **【药物过量】**喹诺酮类药物过量时，可出现以下症状：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、谵狂、小脑共济失调、颅内压升高（头痛、呕吐、淤血性乳头症状）、代谢性酸中度、血糖增高、GOT / GPT / AL

- **P 增高、白细胞减少、嗜酸性粒细胞增加、血小板减少、溶血性贫血、血尿、软骨 / 关节障碍、白内障、视力障碍、色觉异常及复视。**急救措施及解毒药（1）输液（加保肝药物）：代谢性酸中毒给以碳酸氢钠注射液，尿碱化给以碳酸氢钠注射液，以增加本品由肾脏的排泄；（2）强制利尿：给予呋喃苯氨酸注射液；（3）对症疗法：抽搐时应反复投以安定静脉注射液；（4）重症：可考虑进行血液透析。

- **【药理毒理】**药理作用：本品为氧氟沙星的左旋体，其抗菌活性约为氧氟沙星的两倍，它的主要作用机理是通过抑制细菌 DNA 旋转酶（细菌拓扑异构酶 II）的活性，阻碍细菌 DNA 的复制而达到抗菌作用。本品具有抗菌谱广、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、枸橼酸杆菌、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。毒理研究：重复给药毒性：大鼠连续 4 周经口给予本品剂量分别为

50、200、800mg/Kg，仅见 800mg/Kg 用药组动物出现中性白细胞的减少和骨髓 M/E 的上升；病理组织学可见肢关节表面出现轻度的变性改变。猕猴经口投药 4 周，100mg/Kg 组动物出现流涎、腹泻、体重轻度和尿中 pH 值降低。大鼠经口给药 26 周，80 和 320mg/Kg 剂量组动物出现流涎、尿中 pH 高，320mg/Kg 组动物的排粪量增加，盲肠粘膜的杯状细胞出现肿大。猕猴经口给药 26 周时，在 10、25、62.5mg/Kg 剂量下均未出现明显毒性反应。生殖毒性：大鼠妊娠前、妊娠初期经口给药剂量达 360mg/Kg 时，均未见影响雌、雄动物的生殖能力，也未见影响胎儿。大鼠在器官形成期给药，剂量达 90mg/Kg 时，对胎儿和出生儿均未见明显影响。家兔经口给药 50mg/Kg 时，未出现胚胎、胎儿的致死作用以及迟滞胎儿生长的作用，也未出现致畸作用。大鼠围产期、授乳期经口给药达 360mg/Kg 时，对动物的分娩、授乳，以及出生儿均未见明显影响。其它研究：对关节软骨的影响：对幼年和 3-4 周龄大鼠、4 月龄猎兔犬经口给药 7 天时，大鼠在 300mg/Kg 以上、猎兔犬在 10mg/Kg 以上出现关节软骨病变，并在幼、年轻猎兔犬中易发现关节毒性。在 13 月龄犬，经口投药 7 天时，在 40mg/Kg 剂量时出现极轻度的关节毒性。但在 18 月龄犬静脉注射 14 天时，在 30mg/Kg 剂量时未出现关节毒性。光毒性试验：照射长波长紫外线（320

- 400nm），以小鼠耳廓厚度变化为指标研究光毒性时，经口给药剂量达 200mg/Kg 时，未见明显变化。

- **【药代动力学】**目前国内尚缺乏盐酸左氧氟沙星注射液详细药代动力学研究资料。国外资料单次静注左氧氟沙星 300mg 和相同剂量口服给药的药代动力学参数相似。多剂量研究中(300mg 每日两次静脉滴注，共 6 天)，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。左氧氟沙星在体内组织中分布广泛。主要以原型药由尿中排出，口服给药后 48 小时内，尿中原型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的形式由尿中排出。肾功能减退的患者左氧氟沙星清除率下降，消除半衰期延长，为避免药物蓄积，应进行剂量调整。血液透析和连续腹膜透析（CAPD）不影响左氧氟沙星从体内排除。