

hme) 是在美国批准上市的第一个氟喹酮衍生物,其抗菌谱广泛。虽然与喹啉酮抗感染剂如萘啶酸有相似之处,但本品具有更强的抗革兰氏阳性菌和某些革兰氏阴性菌如绿脓杆菌的作用。它主要通过抑制DNA促旋酶而抑制细菌DNA的合成,是一种杀菌剂。

氟喹酮类抗菌药的开发是当前治疗感染性疾病的重要进展。其广谱、高效、不良反应率低和口服有效,用于治疗许多感染性疾病比现行药物表现出明显优点。虽然目前氟哌酸仅指明用于泌尿道感染,可以预言,本品以及几种同类物的适应症将被批准并将很快得到扩展。

氟哌酸适用于治疗成年有并发及无并发的尿道感染,诸如由大肠杆菌、肺炎杆菌、肠杆菌、奇异变形杆菌、吲哚阳性变形杆菌属(普通变形杆菌、摩根氏变形杆菌)、绿脓杆菌、Citrobacter freundii、金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌和D族白色链球菌敏感菌株引起的尿道感染有效。其抗菌谱较其它口服抗感染药如常用于泌尿道感染治疗的羟氨苄青霉素、头孢氨苄和复方新诺明更广。本品对绿脓杆菌的细菌感染特别有效,该菌对多数抗生素不敏感,本品口服的效果,可使一些需要注射抗生素治疗的患者尽早出院。

氟哌酸治疗淋球菌尿道炎和消化道感染也很有效;不过目前这些尚未标示为适应症。对于许多其它类型的感染虽然别的类似物如丙氟哌酸和氟啶酸较本品可能更有效,但对氟喹酮类也正在进行研究。

多数患者对本品耐受良好;不良反应不多见。最常报道的不良反应有恶心(2.8%)、头痛(2.7%)和眩晕(1.8%)。由于本品可引起中枢神经系统效应,必须在患者从事需要精神锐敏或协调的活动之前给药,看看他们对药物是如何的反应。虽然不大可能出现,但仍有结晶尿存在的可能性,患者必需摄取足够量的液体以保证适当的水分和充足尿

排出量。

本品及其相关药物可引致未成熟动物发生关节病。尽管患者是否有此危险的可能性尚不知道,但本品最好不用于儿童或孕妇。

曾报道几种药物与本品有相互作用,因此治疗必须做相应的调整或监护。呋喃妥因可拮抗本品的抗菌作用,故两药不宜合用。与丙磺舒合用可致尿中药物排泄减少。应劝告患者服本品时或服后2小时内禁服抗酸药。

某些患者服用萘啶酸很快产生耐药性。然而,服用本品治疗期间患者产生耐药性低于1%。

本品口服剂量后约30%~40%被吸收。食物的存在可降低吸收。药物通过代谢、胆汁和肾脏排泄而消除。

本品必须在饭前1小时或饭后2小时用一杯开水送服。无并发症的泌尿道感染者,建议剂量为每次400mg,一天二次,疗程7~10天;有并发性的泌尿道感染者为10~21天。最大剂量不得超过800mg/天。肌酐清除率 $\leq 30\text{ml/min}/1.73\text{M}^2$ 的患者,推荐剂量应为400mg,每天一次。

片剂规格为每片含量400mg。本品治疗费用相当高于羟氨苄青霉素或复方新诺明。然而本品口服有效,当用于代替注射应用的抗生素以及当用其治疗可使病人提早出院,那末本新药的应用将可节省费用。

### ◆◆◆◆◆ ◆抗病毒药◆ ◆◆◆◆◆

▲三氮唑核苷(Ribavirin, 病毒唑)。商品名:Virazole,药厂:ICN)是一个合成的为细胞RNA和蛋白质所需要的天然存在的化合物—鸟苷的类似物。谨慎选用于因呼吸道合胞体病毒(RSV)所致的严重下呼吸道感染的住院婴儿和儿童患者,适合于气雾剂治疗。本品为美国批准用于这种感染的

第一种药物(可对某些病人造成生命威胁),因此在现有为数不多的抗病毒药中添加了一种重要的药物。

在美国每年有80万以上婴儿遭受RSV感染。幸好多数感染不局限在下呼吸道或只是轻度的、自限的,并且不需要住院或抗病毒治疗。然而在这些病人中仍约有10万需要住院治疗,而且其中约5%患者死亡,这就造成1岁以下婴儿呼吸系疾病和死亡的最重要原因之一。异常情况如早产或心肺疾患的存在可能增加感染的严重性及病人的危险性。

许多轻度下呼吸道感染的婴儿和儿童只需短暂住院治疗,并不需要用三氮唑核苷治疗。但是本品选择性用于严重感染的患者,对某些病例可能挽救生命。应用三氮唑核苷治疗需同时进行常规呼吸道和体液治疗。由于成人和其它儿童的RSV感染通常是轻微的和自限的,故本品气雾剂对他们不适用。

本品具有广谱抗病毒活性,对其它病毒感染可能也有效,如流感、副流感、水痘、麻疹、单纯疱疹和Lassa热。由于本品口服或注射剂型治疗这些感染的经验有限,故本品尚未标示这些适应症。

据报道三氮唑核苷具有抑制人类免疫缺陷病毒的复制,该病毒是艾滋病的致病因子,因此它可能用于此病已受到广泛的重视。对本品的一种口服配方用于艾滋病正在评价,同时临床研究现在正在进行。目前使用的气雾剂配方不适用于艾滋病的治疗。

三氮唑核苷对动物有致畸作用,因此成人于其他病毒性感染用药应认识到这种危险性。在治疗期孕妇或可能怀孕的妇女禁用本品。

气雾吸入后,本品在全身循环中检测到低浓度。报道的不良反应包括细菌性肺炎、气胸、窒息、低血压、心搏停止和洋地黄样中毒。在临床实验中由于许多患者患有威胁生命的疾病,因此三氮唑核苷导致上述作用

的范围尚不清楚。

婴儿应用本品可发生功能恶化,同样,对患有慢性阻塞性肺病或哮喘成人也有此反应。因此治疗期间必需严密监护呼吸功能。

其它不良反应包括药疹、结膜炎及网状细胞增多症。虽然气雾剂应用不可能产生贫血,而在口服和静注剂型的研究中却屡有出现。

RSV感染的婴儿和儿童患者,本品可用小颗粒气雾发生器(SPAG-2型)吸入给药,它能释放均匀的微细粒子气雾进入下呼吸道的细支气管内。其它气雾剂发生装置则不应使用;本品亦不可与其它气雾化的药品合用。需要帮助吸氧的婴儿不能应用本品,因为此药可能在呼吸器的阀门和管道上沉淀而影响安全和有效通气。

用SPAG-2型气雾器可以把气雾剂释放到婴儿氧气罩内。如果不能利用氧气罩,必需应用面罩或氧气帐幕。每天治疗12~18小时,至少3天,但不超过7天。治疗的同时应该进行常规的呼吸和液体管理。

本品为每100ml玻瓶中含三氮唑核苷6g。使用前以灭菌注射用水或无菌水稀释至300ml(不加防腐剂),最后配成每ml含20mg浓度的溶液。已装入SPAG-2型装置中的溶液应至少每24小时更换弃去。



▲硝酸氟苯硫丁唑 (Butoconazole nitrate, 商品名: Femstat, 药厂: Syntex) 是最新的咪唑类抗真菌药物,适用于治疗念珠菌属引起的外阴阴道的霉菌感染。本品规格为乳膏剂型阴道内给药,本品同其它咪唑类衍生物如克霉唑、咪康唑以及制霉菌素一样有效。

本品也象其它局部应用的抗真菌药一样,耐受良好。某些研究表明,患者用药后可发生外阴或阴道烧灼感(2.3%)、