核准日期：2020年03月03日
修改日期：

抗速平®

盐酸莫西沙星氯化钠注射液说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

警告：严重不良反应，包括肌腱炎和肌腱断裂、周围神经病变、中枢神经系统的影响和重症肌无力加剧。

- **使用氟喹诺酮类药物（包括盐酸莫西沙星），已有报告同时发生致残和潜在的不可逆转的严重不良反应（参见【注意事项】），包括：肌腱炎和肌腱断裂（参见【注意事项】）、周围神经病变（参见【注意事项】）和中枢神经系统的影响（参见【注意事项】）。当发生这些严重不良反应（参见【注意事项】），应立即停用盐酸莫西沙星并避免使用氟喹诺酮类药物（包括盐酸莫西沙星）。**
- **氟喹诺酮类药物（包括盐酸莫西沙星）可能会加剧重症肌无力患者的肌无力症状。已知有重症肌无力病史的患者应避免使用盐酸莫西沙星（参见【注意事项】）。**
- **由于使用氟喹诺酮类药物（包括盐酸莫西沙星）已有报道发生严重不良反应（参见【注意事项】），对于属于下列适应症的患者，应在没有其它药物治疗时方可使用盐酸莫西沙星：**
  - **急性细菌性鼻窦炎（参见【适应症】和【用法用量】）；**
  - **慢性支气管炎急性发作（参见【适应症】和【用法用量】）。**

【药品名称】

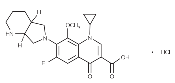
通用名称：盐酸莫西沙星氯化钠注射液
英文名称：Moxifloxacin Hydrochloride and Sodium Chloride Injection
汉语拼音：Yansuan Moxishaxing Lühuana Zhusheye

【成份】

本品主要成份为盐酸莫西沙星。

化学名称：1-环丙基-6-氟-1，4-二氢-8-甲氧基-7-[（4aS，7aS）-八氢-6H-吡咯并[3，4-b]吡啶-6-基]-4-氧代-3-喹啉羧酸盐酸盐

化学结构式：



分子式：$C_{21}H_{24}FN_3O_4 \cdot HCl$
分子量：437.9
本品辅料为：氯化钠、盐酸、氢氧化钠和注射用水

【性状】

本品为黄色的澄明液体。

【适应症】

为了减少耐药细菌的发生，保持盐酸莫西沙星和其他抗菌药物的有效性，盐酸莫西沙星应该仅用于治疗已被证明或强烈怀疑由敏感细菌引起的感染。

在取得培养和药敏信息的情况下，应根据结果选择继续使用或换用其他药物。在缺少这些数据的情况下，当地致病菌的流行病学和敏感谱可能有助于治疗药物的经验选择。

治疗前应进行适当的培养和药敏试验，以分离和鉴定引起感染的微生物，并确定其对盐酸莫西沙星的敏感性。

在获得培养结果之前可能已经选择盐酸莫西沙星进行治疗，一旦获得培养结果，应选择适当的治疗。

盐酸莫西沙星氯化钠注射液用于治疗成人（≥18岁）敏感细菌所引起的下列感染：

1、急性细菌性鼻窦炎：由肺炎链球菌、流感嗜血杆菌或卡他莫拉菌引起。

由于使用氟喹诺酮类药物（包括盐酸莫西沙星）已有报道发生严重不良反应，且对于一些患者，急性细菌性鼻窦炎有自限性，应在没有其它药物治疗时方可使用盐酸莫西沙星。

2、慢性支气管炎急性发作：由肺炎链球菌、流感嗜血杆菌、副流感嗜血杆菌、肺炎克雷伯菌、甲氧西林敏感的金黄色葡萄球菌或卡他莫拉菌引起。

由于使用氟喹诺酮类药物（包括盐酸莫西沙星）已有报道发生严重不良反应，且对于一些患者，慢性支气管炎急性发作有自限性，应在没有其它药物治疗时方可使用盐酸莫西沙星。

3、社区获得性肺炎：由肺炎链球菌（包括多药耐药株）、流感嗜血杆菌、卡他莫拉菌、甲氧西林敏感的金黄色葡萄球菌、肺炎克雷伯菌、肺炎支原体或肺炎衣原体引起。

4、非复杂性皮肤和皮肤组织感染：由甲氧西林敏感的金黄色葡萄球菌或化脓性链球菌引起。

5、复杂性皮肤和皮肤组织感染：由甲氧西林敏感的金黄色葡萄球菌、大肠埃希氏菌、肺炎克雷伯氏菌或阴沟肠杆菌引起。

6、复杂性腹腔内感染：由大肠杆菌、脆弱类杆菌、咽峡炎链球菌、星座链球菌、粪肠球菌、变形杆菌、产气荚膜梭菌、多形类杆菌或消化链球菌属等引起，包括腹腔脓肿。

7、鼠疫，包括成人因鼠疫耶尔森氏杆菌（Y. pestis）引起的肺鼠疫和败血性鼠疫，也可预防鼠疫。

由于可行性原因，无法对人类进行有效性临床研究，因此，该适应症仅是基于动物有效性研究数据所确定。

【规格】

250ml:盐酸莫西沙星（按$C_{21}H_{24}FN_3O_4$计）0.4g与氯化钠2.0g。

【用法用量】

盐酸莫西沙星氯化钠注射液用于感染性疾病（详见【适应症】）的治疗，通用的用法用量如下所示，但必须结合疾病严重程度由临床医生最终确定。

1、成人剂量、疗程和给药方法

盐酸莫西沙星氯化钠注射液的剂量为0.4克（静脉滴注），每24小时一次。治疗的持续时间取决于感染的类型，如表1中所述。

表1：感染类型、剂量和治疗持续时间

感染的类型	每24小时剂量	持续时间（天）
急性细菌性鼻窦炎	0.4g	10
慢性支气管炎急性发作	0.4g	5
社区获得性肺炎	0.4g	7-14
非复杂性皮肤和皮肤组织感染	0.4g	7
复杂性皮肤和皮肤组织感染	0.4g	7-21
复杂性腹腔内感染	0.4g	5-14
鼠疫[a]	0.4g	10-14

a) 在疑似或确认暴露在鼠疫耶尔森氏杆菌后，应立即开始用药。

根据中国健康受试者心脏所能耐受的输液速率以及国内Ⅰ、Ⅱ、Ⅲ期临床研究的结果，推荐本品的输液时间应为90分钟。

静脉注射液给患者（例如，患者无法忍受口服剂型）提供了一个可选择的给药途径。从静脉切换口服时，无需调整剂量。临床医师认为有必要时，可以从开始的静脉给药转换为口服给药。

使用时，请将输液器针头垂直扎入组合盖的垫片标记部位，勿用力过大以避免垫片受损。

2、老年患者

老年患者不必调整用药剂量。

3、肾功能或肝功能不全患者

肝损害：

轻中度肝功能受损的患者（Child Pugh A级或B级）与健康志愿者或肝功能正常的患者血浆药物浓度在临床上无明显差别。

肾损害：

肾功能受损的患者（包括肌酐清除率≤30ml/min/1.73m²）和慢性透析，如血液透析和连续卧床腹膜透析的患者无需调整剂量。

4、给药说明

给药前应检查本品是否有不溶颗粒或变色。应使用澄明，无不溶颗粒的本品。穿刺使用前应对本品进行目视检查，不得使用变色、存在颗粒物质或容器存在破损的产品。

盐酸莫西沙星氯化钠注射液为静脉注射剂，只能用于静脉滴注，不能用于动脉内、肌内、鞘内注射，不能腹膜内或皮下给药。

由于本品与其他注射液的相容性数据较少，本品中不得加入溶媒或其他药物，也不得使用同根静脉输液管同时输注本品，溶媒或其他药物。如使用同根静脉输液管或Y型管来连续滴注其他药物，或采用背负式输液，在滴注本品之前和之后，应使用和本品和其他滴注药物相容的注射液冲洗该管路。

当开具盐酸莫西沙星来治疗某种细菌感染时，应告知患者：尽管在疗程早期病情通常会好转，但仍应遵医嘱使用药物。跳过剂量或不完成整个疗程可能会（1）降低紧急治疗的有效性；（2）增加细菌耐药性形成的可能性，未来将不能使用盐酸莫西沙星或其他抗菌药进行治疗。

5、药物相容性

比例在1:10至10:1之间时，本品与下列静脉注射液相容：

0.9%氯化钠注射液	无菌注射用水
1M 氯化钠注射液	10%葡萄糖注射液
5%葡萄糖注射液	乳酸林格注射液

6、种族差异

对高加索人、日本人、黑人及其他种族人群进行了可能的种族间差别试验，未发现临床相关的药代动力学差别。因此，不同种族间不必调整药物剂量。

【不良反应】

1、严重和其他重要的不良反应

- 致残和潜在的不可逆转的严重不良反应，包括肌腱炎和肌腱断裂，周围神经病变，中枢神经系统的影响
- 肌腱病和肌腱断裂
- QT间期延长
- 过敏反应
- 其他严重并且有时致命的反应
- 中枢神经系统的影响
- 艰难梭菌相关性腹泻
- 周围神经病变
- 对血糖的干扰
- 光敏感性/光毒性
- 耐药菌的形成

在**【注意事项】**下对以上不良反应进行了详细说明。

2、 临床试验的经验

由于临床试验实施的条件不同，在临床实验中观察到的药物不良反应发生率不能直接与另一种药物比较，可能也不能反映实际发生率。

下面数据描述的是在不同条件下71项盐酸莫西沙星同活性药物对照的Ⅱ-Ⅳ期临床试验。共14981例患者使用盐酸莫西沙星，平均年龄为50岁（约73%的患者小于65岁），50%为男性，63%是白人，12%是亚裔，9%是黑人。患者接受0.4g盐酸莫西沙星每日一次，口服、静脉滴注或序贯给药（静脉滴注后改为口服）。治疗时间通常是6～10天，平均治疗天数为9天。

5%的患者由于发生不良事件停止使用盐酸莫西沙星。4.1%的患者口服0.4g 盐酸莫西沙星，3.9%的患者静脉给药0.4g，8.2%的患者采用序贯疗法0.4g口服/静脉给药。在口服0.4g剂量的患者中，导致停药的最常见不良事件（>0.3%）是恶心、腹泻、头晕、呕吐。在静脉滴注0.4g剂量的患者中，导致停药的最常见不良事件是皮疹。在注射/口服序贯治疗剂量的患者中，导致停药的最常见不良事件是腹泻和发热。

在接受盐酸莫西沙星治疗的患者中，不良反应≥1%和不太常见的不良反应（发生率在0.1%至<1%）分别显示在表2和表3中。最常见的药物不良反应（3%）有恶心、腹泻、头痛、头晕。

表2：盐酸莫西沙星与活性对照药物的临床试验中常见（≥1%）不良反应

系统器官分类	不良反应	发生率%（N=14981）
血液和淋巴系统疾病	贫血	1
胃肠道疾病	恶心	7
	腹泻	6
	呕吐	2
	便秘	2
	腹部疼痛	2
	消化不良	1
全身性疾病及给药部位反应	发热	1
各类检查	谷丙转氨酶升高	1
代谢和营养类疾病	低钾血症	1
神经系统疾病	头痛	4
	头晕	3
精神疾病	失眠	2

表3：盐酸莫西沙星与活性对照药物的临床试验中不常见（0.1%～<1%）不良反应（N=14981）

系统器官分类	不良反应
血液和淋巴系统疾病	血小板增多症、嗜酸性粒细胞增多症、中性粒细胞减少症、血小板减少症、白细胞减少症、白细胞增多症
心脏疾病	心房颤动、心悸、心动过速、心绞痛、心力衰竭、心脏骤停、心动过缓
耳和迷路类疾病	眩晕、耳鸣
眼器官疾病	视觉模糊
胃肠道疾病	口腔干燥、腹部不适、肠胃气胀、腹胀、胃炎、胃食管反流病
全身性疾病及给药部位反应	疲劳、胸部疼痛、虚弱、疼痛、不适、输液外渗、水肿、寒战、胸部不适、面部疼痛
肝胆系统疾病	肝功能异常
感染和侵染类疾病	念珠菌病、阴道感染、真菌感染、胃肠炎
各类检查	谷草转氨酶升高、谷氨酰胺转肽酶升高、碱性磷酸酶升高、心电图QT间期延长、血乳酸脱氢酶升高、血淀粉酶升高、脂肪酶升高、血肌酐升高、血尿素升高、红细胞压积降低、凝血酶原时间延长、嗜酸性粒细胞计数升高、部分凝血酶原激活时间延长、血甘油三脂升高、血尿酸升高
代谢和营养类疾病	高血糖、厌食症、低血糖、高脂血症、食欲下降、脱水
肌肉骨骼和结缔组织疾病	背痛、肢端疼痛、关节痛、肌肉痉挛、骨骼疼痛
神经系统疾病	味觉障碍、困倦、震颤、昏睡、感觉异常、紧张性头痛、感觉迟钝、晕厥
精神疾病	焦虑、混乱状态、躁动、抑郁、紧张不安、烦躁、幻觉、定向障碍
肾脏及泌尿系统疾病	肾衰、排尿困难
生殖系统和乳腺疾病	外阴部瘙痒
呼吸系统、胸和纵膈疾病	呼吸困难、哮喘、气喘、支气管痉挛
皮肤和皮下组织类疾病	皮疹、瘙痒、多汗、红斑、荨麻疹、过敏性皮炎、夜间盗汗
血管疾病	高血压、低血压、静脉炎

3、实验室检查参数变化

以下实验室检查参数的变化在上面表中并未列出，是在≥2%患者中发生且发生率高于对照组，但不考虑与药物的因果关系得出的：

红细胞平均血红蛋白、中性粒细胞、白细胞计数、凝血酶原时间比值、钙离子、氯离子、清蛋白、球蛋白、胆红素升高；血红蛋白、红细胞、中性粒细胞、嗜酸性粒细胞、嗜碱性粒细胞、凝血酶原时间比值、葡萄糖、氧分压、胆红素、淀粉酶降低。

不能确定上述实验室异常是由于药物或被治疗的原发疾病所引起的。

4、上市后的经验

表4列出了上市后已明确的使用盐酸莫西沙星以后所报告的不良反应。由于这些反应均来自由无法确定数量的人群的自发报告，因此并不能完全据此估计发生率或确定与使用药物有因果关系。

表4：上市后报告的药物不良反应

系统/器官分类	不良反应
血液和淋巴系统疾病	粒细胞缺乏症、全血细胞减少症
心脏疾病	室性快速型心律失常（包括在非常罕见的情况下心脏骤停和尖端扭转型室性心动过速），通常在患者并发严重的药物性心律失常时发生
耳和迷路疾病	听力损害，包括耳聋（一般可以逆转）
眼器官疾病	视觉丧失（特别是在中枢神经系统反应过程中，大部分是一过性的）
肝胆系统疾病	肝炎（主要是淤胆型）、肝脏衰竭（包括死亡病例）、黄疸、急性肝坏死
免疫系统疾病	过敏反应、过敏性休克、血管性水肿（包括喉头水肿）
肌肉骨骼和结缔组织疾病	肌腱断裂
神经系统疾病	协调障碍、步态异常、重症肌无力（加重）、肌肉无力、周围神经病变（可能不可逆），多发性神经病
精神疾病	精神病反应（非常罕见病例可能最终致自我伤害行为如自杀意念/自杀想法或企图自杀）
肾脏和泌尿系统疾病	肾功能障碍、间质性肾炎
呼吸系统、胸和纵膈疾病	过敏性肺炎
皮肤和皮下组织类疾病	光敏性/光毒性反应、Stevens-Johnson综合征、中毒性表皮坏死松解症

【禁忌】

1、已知对莫西沙星、其他喹诺酮类药物或任何辅料过敏者禁用。
2、妊娠和哺乳期妇女禁用。
3、由于临床数据有限，患有肝功能损伤（Child Pugh C级）的患者和转氨酶升高大于5倍正常值上限的患者应禁止使用盐酸莫西沙星。
4、18岁以下患者禁用。
5、有喹诺酮类药物治疗相关肌腱疾病/病症病史的患者禁用。
6、在临床前研究及在人体研究的研究数据显示，暴露于莫西沙星后曾经观察到心脏电生理改变，表现为QT间期延长。

基于安全性考虑，下列患者禁用莫西沙星：
（1）先天性或证明有获得性QT间期延长患者；
（2）电解质紊乱，尤其是未纠正的低钾血症患者；
（3）有临床意义的心动过缓患者；
（4）有临床意义的心力衰竭并伴有左心室射血分数降低患者；
（5）既往发生过有症状的心律失常患者。

7、盐酸莫西沙星不应与其他能延长QT间期的药物同时使用。

【注意事项】

1、致残和潜在的不可逆转的严重不良反应，包括肌腱炎和肌腱断裂、周围神经病变和中枢神经系统的影响。

使用氟喹诺酮类药物（包括盐酸莫西沙星），已有报告在同一患者的身体不同器官系统同时发生致残和潜在的不可逆转的严重不良反应，通常包括：肌腱炎、肌腱断裂、关节痛、肌痛、周围神经病变和中枢神经系统反应（幻觉、焦虑、抑郁、失眠、严重头痛和错乱）。这些不良反应可发生在使用盐酸莫西沙星后数小时至数周。任何年龄段的患者，之前没有相关风险因素，均有报告发生这些不良反应。

2、肌腱病和肌腱断裂

氟喹诺酮类药物，包括盐酸莫西沙星，会使所有年龄段患者的肌腱炎和肌腱断裂的风险增加。这种不良反应最常发生在跟腱，跟腱断裂可能需要手术修复。也有报告在肩，手部，肱二头肌，拇指和其他肌腱点出现肌腱炎和肌腱断裂。肌腱炎和肌腱断裂可发生在开始使用莫西沙星后数小时或数天，或结束治疗后几个月。肌腱炎和肌腱断裂可双侧发生。这种风险在60岁以上老年患者，服用皮质类固醇药物患者及肾脏、心脏或肺移植手术的患者中进一步增加。除了年龄和使用皮质类固醇的因素外，另可独立增加肌腱断裂风险的因素包括剧烈的体力活动，肾功能衰竭以及以前的肌腱疾病，如类风湿关节炎。肌腱炎和肌腱断裂也发生在没有上述风险因素的使用氟喹诺酮类药物的患者中。肌腱断裂可发生在治疗过程中或治疗结束后；也有报告在治疗结束数月后发生肌腱断裂。在患者发生肌腱疼痛，肿胀，炎症或断裂后，应停止使用本品。在出现肌腱炎或肌腱断裂的迹象后，应建议患者休息，并与医生联系，换用非喹诺酮类抗生素药物。有肌腱疾病病史或发生过肌腱炎和肌腱断裂的患者应避免使用氟喹诺酮类抗生素，包括盐酸莫西沙星。

3、重症肌无力加重

氟喹诺酮类药物，包括盐酸莫西沙星，有神经肌肉阻断活性，可能加剧重症肌无力患者的肌无力症状。上市后的严重不良事件，包括死亡和需要通气支持，和患有重症肌无力患者使用氟喹诺酮类药物相关。患有重症肌无力的患者应避免使用盐酸莫西沙星。

4、 QT间期延长

盐酸莫西沙星已被证明可使某些患者的心电图QT间期延长。口服0.4g的盐酸莫西沙星，从给药前至盐酸莫西沙星达最大浓度时，平均QTc变化为6msec(±26) (n=787)。静脉滴注0.4g的盐酸莫西沙星（每天滴注时间为1小时），从给药前至给药第1天时，平均QTc变化为10msec(±22) (n=667)，第3天平均QTc变化为7msec(±24) (n=667)。

由于缺乏这些患者的用药经验，本品应避免用于下列患者：
· 已知QT间期延长；
· 室性心律失常，包括尖端扭转型，因为QT间期延长可能导致发生这些状况的风险增加；
· 持续的心律失常状况，如具有临床显著性的心动过缓和急性心肌缺血；
· 未治疗的低钾血症或低镁血症；
· 使用抗心律失常ⅠA类药物（例如，奎尼丁、普鲁卡因胺）或Ⅲ类药物（例如，胺碘酮、索他洛尔）；
· 其他延长QT间期的药物，如西沙必利、红霉素、抗精神病药物和三环抗抑郁药。

老年患者使用盐酸莫西沙星的注射液可能更容易发生药物相关的QT间期延长。

患有轻度、中度或重度肝硬化，代谢紊乱伴随肝功能不全的患者使用本品可能会导致QT间期延长。肝硬化患者使用盐酸莫西沙星应监测心电图。

QT间期延长的程度会随着药物浓度或者注射液的输液速率的增加而增加，因此，不应超过推荐剂量或滴注速度。

在上市前临床试验中，798例使用盐酸莫西沙星的患者和702例同时使用已知可致QT间期延长药物的对照患者的心血管不良事件的发生率相似。在超过15500例患者使用盐酸莫西沙星的对照临床研究中，包括759例在治疗开始时为低血钾的患者，没有因QT间期延长导致的心血管疾病发病率或死亡率的增加。在1项超过18000例患者使用盐酸莫西沙星片上市后观察性研究中，没有观察到死亡率的增加，这些患者未进行心电图的检测。

5、过敏反应

使用喹诺酮类药物，包括盐酸莫西沙星的患者，已报告发生严重的过敏反应。一些患者在第一次给药后即发生，有些反应可伴随有心血管系统衰竭、丧失意识、刺痛、咽或面部水肿、呼吸困难、荨麻疹、瘙痒等。严重的过敏反应需要肾上腺素紧急治疗。盐酸莫西沙星应在第一次出现皮疹或其他任何过敏迹象时停止使用。必要时可进行输氧，静脉注射类固醇，气道管理，包括插管等措施。

6、其他严重并且有时致命的反应

使用喹诺酮类药物，包括盐酸莫西沙星的患者，已有出现其他严重并且有时致命的事件的报告。这些事件中有些是由于过敏，有些则病因不明。这些事件可能是重度的，通常发生在多剂量给药后。临床表现可包括以下的一个或多个症状：发热、皮疹、严重的皮肤反应（例如，中毒性表皮坏死松解症，Stevens-Johnson综合征）；血管炎；关节痛；肌痛；血清病；过敏性肺炎；间质性肾炎；急性肾功能不全或肾衰竭；肝炎、黄疸、急性肝坏死或肝功能衰竭；贫血，包括溶血性贫血和再生障碍性贫血；血小板减少症，包括血栓性血小板减少性紫癜；白细胞减少症；粒细胞缺乏症；全血细胞减少症和/或其他血液学异常。

应在第一次出现皮疹、黄疸或任何其他过敏表现时立即停药并且采取措施。

7、中枢神经系统的影响

使用氟喹诺酮类药物，包括盐酸莫西沙星，已有报告会使中枢神经系统不良反应的风险增加，包括：惊厥和颅内压增高（包括假性脑瘤）以及中毒引起的精神病。使用氟喹诺酮类药物可能会导致中枢神经系统反应包括焦躁、激动、失眠、焦虑、噩梦、偏执狂、头晕、错乱、震颤、幻觉、抑郁和自杀想法或行为。这些反应可能发生在首次用药后。如果这些反应发生在患者使用盐酸莫西沙星时，应停止给药并采取适当的措施。与所有的氟喹诺酮类药物一样，已知或怀疑有中枢神经系统疾病的患者（例如，严重的脑动脉硬化、癫痫）或存在其他风险因素的患者（如有发作倾向或发作阈值降低）应在获益超过风险时使用盐酸莫西沙星。

8、周围神经病变

已有报告患者使用氟喹诺酮类药物，包括盐酸莫西沙星，产生罕见的感觉或感觉运动性轴索神经病，影响小和/或大的轴索，致皮肤感觉异常、感觉迟钝、触物痛感和衰弱。对于某些患者，症状可能在盐酸莫西沙星用药后很快发生并且可能是不可逆的。如果患者出现外周神经病变症状，包括疼痛、烧灼感、麻刺感、麻木和/或无力，或其他感觉，包括轻触觉、痛觉、温觉、位置觉和振动觉的变化，应立即停药。

有周围神经病变病史的患者应避免使用氟喹诺酮类抗生素，包括盐酸莫西沙星。

9、精神病学反应

即使在第一次使用喹诺酮类药物后（包括莫西沙星）也可能会发生精神病学反应。在非常罕见病例中出现了发展为自杀意念和自我伤害行为的抑郁或精神病反应，例如企图自杀等。如果患者出现了上述反应，应该停止使用莫西沙星并进行适当的疾病治疗。精神病患者或有精神性疾病病史的患者应慎用莫西沙星。

10、艰难梭菌相关性腹泻

几乎所有的抗菌药物均出现过艰难梭菌相关性腹泻（CDAD）的报告，包括盐酸莫西沙星，严重程度从轻度腹泻至严重结肠炎。抗菌药物治疗使结肠的正常菌群改变，从而导致艰难梭菌过度生长。

艰难梭菌产生的毒素A和B，是艰难梭菌相关性腹泻的原因。高毒性的梭菌引起的发病率和死亡率均升高，这些感染抗菌治疗无效，并可能需要结肠切除术。在接收抗生素治疗后，出现腹泻均应考虑CDAD的可能性。因为CDAD可能发生在使用抗菌药物治疗后两个月，因此仔细询问病史是必要的。

如果怀疑或证实艰难梭菌相关性腹泻，可能需要停止目前使用的不针对艰难梭菌的抗生素。应适当补充液体和电解质，补充蛋白质，采用针对艰难梭菌的抗生素治疗，出现临床指征时应进行手术评价。

11、动物的关节病

口服盐酸莫西沙星引起未成熟犬跛行。负重关节的组织病理学检查发现这些犬软骨永久性改变。

相关喹诺酮类药物也产生负重关节的软骨糜烂以及在未成熟的各种动物物种产生其他关节症状。

12、对血糖的干扰

和所有氟喹诺酮类药物一样，使用盐酸莫西沙星有报告血糖受到干扰，包括高血糖和低血糖。在使用盐酸莫西沙星的患者中，血糖障碍主要发生于那些同时口服降糖药（如磺酰脲类药物）或使用胰岛素的老年患者中。对于糖尿病患者，需更加注意监测血糖。如发生低血糖，需立即停用盐酸莫西沙星并开展适当治疗。

13、光敏感性/光毒性

在使用喹诺酮类抗生素后暴露于阳光或紫外线照射下，会发生中度至严重的光敏性/光毒性反应，后者可能表现过度的晒伤反应（例如，烧灼感、红斑、水泡、渗出、水肿），常在暴露于光的部位出现（通常是脖子的“V”型区域、前臂伸肌表面、手的背部）。因此，应该避免过度暴露于光源下。发生光毒性反应时应停药。

14、细菌耐药性的发生

在没有证据证明高度疑似细菌感染或用来预防细菌感染的情况下，使用盐酸莫西沙星并不能使患者受益，反而会增加耐药菌发生的风险。

15、对驾驶或操作机械能力的影响

没有进行有关盐酸莫西沙星对驾驶和操作机械能力的影响方面的试验。然而，包括盐酸莫西沙星在内的氟喹诺酮类药物可能会导致患者出现中枢神经系统反应（如头晕，急性、短暂的目盲，参见【不良反应】）或急性和短时间的意识丧失（晕厥，参见【不良反应】），会损害患者的驾驶或操作机械的能力。应当建议患者在驾驶或操作机械之前考虑自己对盐酸莫西沙星是否有反应。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

孕妇：

怀孕类别C。

动物研究显示盐酸莫西沙星有生殖毒性，但对人的潜在危险性尚不明确。人类在怀孕期间使用盐酸莫西沙星的安全性尚未被证实，儿童服用喹诺酮类药物可引起可逆性关节损伤。因此，盐酸莫西沙星禁用于妊娠期的妇女。

哺乳期妇女：

与其他喹诺酮类药物相同，盐酸莫西沙星可造成未成年试验动物负重关节的软骨损伤。临床前研究证实小量的盐酸莫西沙星可以分布到人类的乳汁中，尚缺乏哺乳期妇女的数据。因此，盐酸莫西沙星禁用于哺乳期的妇女。

【儿童用药】

儿童和青少年（<18岁）禁止使用盐酸莫西沙星。尚未确定盐酸莫西沙星在儿童和青少年中的有效性和安全性。

【老年用药】

老年患者不必调整用药剂量。

老年患者在使用氟喹诺酮类药物，如盐酸莫西沙星时会增加严重肌腱疾病，包括肌腱断裂的风险，在患者同时接受皮质类固醇治疗时，这种风险会进一步增加。肌腱炎或肌腱断裂可以涉及跟腱、手、肩或其他肌腱所在位置，可能发生在治疗期间或完成治疗之后，已有报告在使用氟喹诺酮类药物治疗数月后发生肌腱炎或肌腱断裂。在向老年患者，尤其是同时使用皮质类固醇的老年患者开具处方时应谨慎，患者应该被告知这个潜在的副作用，并建议如果发生任何症状的肌腱炎或肌腱断裂应停用盐酸莫西沙星并联系医生。

一项多剂量对照临床试验，口服盐酸莫西沙星的患者中有23%的患者大于或等于65岁，9%是大于或等于75岁。临床试验数据证明，65岁及以上的老年患者口服盐酸莫西沙星的安全性和有效性与普通成年人相比无差异。

在静脉滴注盐酸莫西沙星的试验中，患者年龄65周岁及以上的占42%，年龄75周岁及以上的占23%。临床试验数据表明，65周岁及以上的患者静脉滴注盐酸莫西沙星的安全性与对照组一致。总体而言，老年患者更容易受与QT间期相关药物的影响。因此，服用可导致QT间期延长的药物（如ⅠA类或Ⅲ类抗心律失常药物）的患者或具有尖端扭转型室性心动过速风险因素（如已知QT间期延长，未纠正的低钾血症）的患者应避免使用盐酸莫西沙星。

【药物相互作用】

1、抗酸药、硫糖铝、复合维生素和其他含有多价阳离子的产品

喹诺酮类药物会与碱金属和过渡态金属阳离子以螯合物形式结合。喹诺酮类药物与含有铝、镁、硫酸铝、金属阳离子的口服抗酸药，或含有铁、锌复合维生素，或与处方中含有二价和三价阳离子如去羟肌苷咀嚼/缓释片或小儿口服颗粒同时使用，可能大大影响其吸收，导致血浆中的喹诺酮类药物浓度远低于预期。因此，应在使用这些药物至少4小时前或8小时后口服盐酸莫西沙星片。

2、华法林

有报告称喹诺酮类药物，包括盐酸莫西沙星有增强华法林或其衍生物对患者的抗凝效果。此外，患者所患的感染性疾病及其伴随炎症过程、年龄和一般状态都是抗凝活性增加的危险因素。因此，如果喹诺酮类药物与华法林或其衍生物合并使用，必须严密监控患者的凝血酶原时间、国际标准化比值（INR）或其他合适的抗凝测试。

3、抗糖尿病药物

同时使用抗糖尿病药物和氟喹诺酮类药物的患者有报告血糖受到干扰，包括高血糖和低血糖。因此，当上述药物联用时，需密切监测血糖，如发生低血糖反应，需立即停用盐酸莫西沙星并开展适当治疗。

4、 非甾体类抗炎药（NSAIDs）

虽然在临床前研究和临床试验中均没有得到相关结论，但喹诺酮类药物和非甾体类抗炎药联用会增加患者中枢神经系统的刺激和抽搐的风险。

5、延长QT间期的药物

有限的资料表明盐酸莫西沙星和其他有延长QT间期作用的药物联用时具有潜在药效学相互作用。已证实Ⅲ类抗心律失常药索他洛尔和大剂量盐酸莫西沙星的注射液联用后对犬有进一步延长QT间期的作用。因此，应避免盐酸莫西沙星与ⅠA类和Ⅲ类抗心律失常药同时使用。

【药物过量】

单剂量口服用药到2.8g，未观察到严重不良事件发生。 如出现急性过量的情况，应排空胃并保持充足的水分。由于可能会引起患者QT间期延长，应进行心电监护，并仔细观察，根据患者临床情况给予患者适当的支持治疗。药物过量后口服活性炭可有效防止莫西沙星系统暴露的过量增加。约3%和9%的莫西沙星以2%和4.5%的葡萄糖醛酸代谢产物可分别通过连续卧床腹膜透析和血液透析除去。

单剂量口服2000mg/kg、500mg/kg和1500mg/kg盐酸莫西沙星，可以分别导致大鼠、小鼠和食蟹猴死亡。静脉注射小鼠和大鼠的最小致死剂量为100mg/kg。临床表现包括中枢神经系统（CNS）和消化系统症状如活动力下降、震颤、抽搐、呕吐和腹泻。

【临床试验】

1、慢性支气管炎急性发作

一项在美国进行的随机、双盲、对照的临床试验，评价了盐酸莫西沙星片（400mg每日一次，连用5天）对慢性支气管炎急性发作的治疗情况。该研究共纳入629名患者，对盐酸莫西沙星片与克拉霉素片（500mg每日两次，连用10天）进行了比较。该研究评价了给药后7-17天的临床治愈率。盐酸莫西沙星片的临床治愈率为89%(222/250)，克拉霉素片的临床治愈率为89%(224/251)。

表5：按病原菌分类的临床可评价患者在随访访视时的临床治愈率（慢性支气管炎急性发作）

病原菌	盐酸莫西沙星片	克拉霉素片
肺炎链球菌	16/16(100%)	20/23(87%)
流感嗜血杆菌	33/37(89%)	36/41(88%)
副流感嗜血杆菌	16/16(100%)	14/14(100%)
卡他莫拉菌	29/34(85%)	24/24(100%)
金黄色葡萄球菌	15/16(94%)	6/8(75%)
肺炎克雷伯菌	18/20(90%)	10/11(91%)

盐酸莫西沙星治疗组的微生物杀灭率（杀灭+推测杀灭）为：肺炎链球菌100%、流感嗜血杆菌89%、副流感嗜血杆菌100%、卡他莫拉菌85%、金黄色葡萄球菌94%和肺炎克雷伯菌85%。

2、社区获得性肺炎

在美国进行的一项随机、双盲、对照的临床试验，对盐酸莫西沙星片（400mg每日一次）与高剂量克拉霉素片（500mg每日两次）用于治疗经临床和放射检查证明患有社区获得性肺炎的患者的疗效进行了比较。该研究共纳入474名患者（其中382名患者适合纳入第14-35天随访访视时进行的疗效分析）。盐酸莫西沙星片组和高剂量克拉霉素片组中，临床可评价患者的临床治愈率分别为95%（184/194）和95%（178/188）。

在美国和加拿大进行的一项随机、双盲、对照试验，对盐酸莫西沙星Ⅳ/PO序贯给药（400mg每日一次，连续给药7-14天）与Ⅳ/PO氟喹诺酮类对照药（曲伐沙星或左氧氟沙星）用于治疗经临床和放射检查证明患有社区获得性肺炎的患者的疗效进行了比较。该研究共纳入516名患者（其中362名患者适合纳入第7-30天治疗后访视时进行的疗效分析）。盐酸莫西沙星组和氟喹诺酮类对照组的临床治愈率分别为86%（157/182）和89%（161/180）。

在美国以外的地区进行的一项开放研究共纳入628名患者，对盐酸莫西沙星与阿莫西林/克拉维酸盐Ⅳ/PO序贯给药（1.2g静脉给药，每8小时一次/625mg口服，每8小时一次）单独给药或联合高剂量Ⅳ/PO克拉霉素（500mg每日两次）进行了比较。对照药的注射液制剂未获得FDA的批准。给药后第5-7天，盐酸莫西沙星组的临床治愈率为93%（241/258），优于阿莫西林/克拉维酸盐±克拉霉素（85%，239/280）[莫西沙星与对照药的治愈率差异的95%置信区间为（2.9%，13.2%）]。第21-28天治疗后访视时，盐酸莫西沙星组的临床治愈率为84%(216/258)，优于对照药（74%，208/280）[莫西沙星与对照药的治愈率差异的95%置信区间为（2.6%，16.3%）]。

4项社区获得性肺炎（CAP）研究按病原菌分类的临床治愈率如表6所示。

表6：按病原菌分类的临床治愈率（CAP研究汇总数据）

病原菌	盐酸莫西沙星	
肺炎链球菌	80/85	(94%)
金黄色葡萄球菌	17/20	(85%)
肺炎克雷伯菌	11/12	(92%)
流感嗜血杆菌	56/61	(92%)
肺炎衣原体	119/128	(93%)
肺炎支原体	73/76	(96%)
卡他莫拉菌	11/12	(92%)

3、由耐多药肺炎链球菌（MDRSP）引起的社区获得性肺炎

盐酸莫西沙星可有效治疗耐多药肺炎链球菌MDRSP*分离株引起的社区获得性肺炎（CAP）。在37名具有MDRSP分离株的微生物学可评价患者中，35名患者（95%）在治疗后实现临床和细菌学治愈。基于治疗患者人数的临床治愈率和细菌学治愈率如表7所示。

* 耐多药的肺炎链球菌（MDRSP）包括之前已知为耐青霉素肺炎链球菌（PRSP）的分离株以及耐下列两种或以上抗生素的分离株：青霉素（MIC≥2 mcg/mL）、第二代头孢菌素（比如：头孢呋辛）、大环内酯类药物、四环素类药物以及甲氧苄啶/磺胺甲噁唑。

表7：采用盐酸莫西沙星治疗MDRSP CAP的患者的临床治愈率和细菌学治愈率（人群：适合进行疗效分析）

敏感性筛选	临床治愈率		细菌学治愈率	
	n/N[a]	%	n/N[b]	%
耐青霉素	21/21	100%[c]	21/21	100%[c]
耐第二代头孢菌素	25/26	96%[c]	25/26	96%[c]
耐大环内脂[d]	22/23	96%	22/23	96%
耐甲氧苄啶/磺胺甲噁唑	28/30	93%	28/30	93%
耐四环素	17/18	94%	17/18	94%

a) n=治愈的患者人数；N=具有MDRSP的患者人数（共计37名患者中选取）
b) n=治愈的患者人数（推测杀灭或杀灭）；N=具有MDRSP的患者人数（共计37名患者中选取）
c) 一名患者的呼吸道分离株对青霉素和头孢呋辛有耐药性，但血液分离株对青霉素和头孢呋辛中介。该患者被纳入基于呼吸系统分离株的数据库中。
d) 阿奇霉素、克拉霉素和红霉素是供试的大环内酯类抗菌药。

并非所有的分离株均对供试的所有类别的抗菌药有耐药性。治愈率和杀灭率如表8所示。

表8：耐药肺炎链球菌（社区获得性肺炎）的临床治愈率和细菌杀灭率

耐多药肺炎链球菌	临床治愈率	细菌杀灭率
耐2种抗菌药	12/13(92.3%)	12/13(92.3%)
耐3种抗菌药	10/11(90.9%)[a]	10/11(90.9%)[a]
耐4种抗菌药	6/6(100%)	6/6(100%)
耐5种抗菌药	7/7(100%)[a]	7/7(100%)[a]
伴有耐多药肺炎链球菌的菌血症	9/9(100%)	9/9(100%)

a) 一名患者的呼吸道分离株耐5种抗菌药，血液分离株耐3种抗菌药。该患者被纳入耐5种抗菌药的分类中。

4、急性细菌性鼻窦炎

在美国进行的一项双盲对照研究，对盐酸莫西沙星片（400mg每日一次，连续给药10天）与头孢呋辛酯（250mg每日两次，连续给药10天）用于治疗急性细菌性鼻窦炎的情况进行了比较。该试验纳入457名适合进行疗效分析的患者。盐酸莫西沙星片组与头孢呋辛组在治疗后第7-21天进行的治愈检验访视时的临床治愈率（治愈+改善）分别为90%和89%。

另进行了一项非对照研究，以收集细菌学数据并评价成人患者采用盐酸莫西沙星片（400mg每日一次，连续给药7天）治疗时的细菌杀灭率。该研究中，患者全部行窦穿刺（n=336）。治疗后第21-37天进行的随访访视时，肺炎链球菌、卡他莫拉菌和流感嗜血杆菌的临床治愈率和杀灭率/推测杀灭率分别为97%（29/30）、83%（15/18）和80%（24/30）。

5、非复杂性皮肤和皮肤组织感染

在美国进行的一项随机、双盲、对照的临床试验，对盐酸莫西沙星（口服，400mg每日一次，连续给药7天）与头孢氨苄盐酸盐（口服，500mg每日三次，连续给药7天）的疗效进行了比较。该研究中，有30%的患者治疗非复杂性脓肿、8%治疗疖、16%治疗蜂窝织炎、20%治疗脓疱病，26%治疗其他皮肤感染。盐酸莫西沙星组和对照组分别有17%和14%的患者施行辅助程序（切开和引流或清创）。盐酸莫西沙星组和头孢氨苄盐酸盐组中，可评价患者的临床治愈率分别为89%（108/122）和91%（110/121）。

6、复杂性皮肤和皮肤组织感染

复杂性皮肤和皮肤结构感染（cSSSI）进行两项随机、活性对照试验。一项为双盲试验，主要在北美地区进行，对盐酸莫西沙星Ⅳ/PO序贯给药（400mg每日一次，连续给药7-14天）与Ⅳ/PO对照品β-内酰胺/β-内酰胺酶抑制剂用于治疗cSSSI患者的疗效进行了比较。该研究共纳入617名患者，其中335名患者适合进行疗效分析。另一项为国际开放研究，对盐酸莫西沙星（400mg每日一次，连续给药7-21天）与对照品β-内酰胺/β-内酰胺酶抑制剂Ⅳ/PO序贯给药用于治疗cSSSI患者的情况进行了比较。该研究共纳入804名患者，其中632名患者适合进行疗效分析。这些研究中，盐酸莫西沙星组和对照组中分别有55%和53%的患者进行手术切开、引流或清创，该辅助操作构成本适应症治疗所必需的一部分。治愈率随诊断类型而变化，从感染性溃疡患者的61%到并发丹毒患者的90%。这些治愈率与对照组观察到的治愈率相似。可评价患者的总体治愈率以及按病原菌分类的临床治愈率如表9和表10所示。

表9：复杂性皮肤和皮肤组织感染患者的总体临床治愈率

研究	盐酸莫西沙星 n/N(%)	对照药 n/N(%)	95%置信区间*
北美	125/162(77.2%)	141/173(81.5%)	（-14.4%，2%）
国际	254/315(80.6%)	268/317(84.5%)	（-9.4%，2.2%）

* 莫西沙星与对照药之间的治愈率差异（莫西沙星 - 对照药）

表10：复杂性皮肤和皮肤组织感染患者按病原菌分类的临床治愈率

病原菌	盐酸莫西沙星 n/N(%)	对照药 n/N(%)
金黄色葡萄球菌 (对甲氧西林敏感的分离株)[a]	106/129(82.2%)	120/137(87.6%)
大肠杆菌	31/38(81.6%)	28/33(84.8%)
肺炎克雷伯菌	11/12(91.7%)	7/10(70%)
阴沟肠杆菌	9/11(81.8%)	4/7(57.1%)

a) 甲氧西林敏感性只在北美研究中测定

7、复杂性腹腔内感染

复杂性腹腔内感染进行了两项随机、活性对照试验。一项为双盲试验，主要在北美地区进行，对盐酸莫西沙星IV/PO序贯给药（400mg每日一次，连续给药5-14天）与哌拉西林/他唑巴坦静脉给药后口服阿莫西林/克拉维酸用于治疗复杂性腹腔内感染（cIAI）患者（包括腹膜炎、脓肿、伴穿孔的阑尾炎及肠穿孔）的疗效进行了比较。该研究共纳入681名患者，其中379名患者被视为临床可评价患者。另一项为国际开放研究，对盐酸莫西沙星（400mg每日一次，连续给药5-14天）与头孢曲松静脉给药+甲硝唑静脉给药后口服阿莫西林/克拉维酸用于治疗cIAI患者的情况进行了比较。该研究共纳入595名患者，其中511名患者被视为临床可评价患者。临床可评价的人群由经手术确诊发生复杂性感染、至少给药5天以及治愈检验访视时患者进行第25-50天随访评估的受试者。临床可评价受试者的总体临床治愈率如表11所示。

表11：复杂性腹腔内感染患者的临床治愈率

研究	盐酸莫西沙星 n/N(%)	对照药 n/N(%)	95%置信区间*
北美（总计）	146/183(79.8%)	153/196(78.1%)	(-7.4%,9.3%)
脓肿	40/57(70.2%)	49/63(77.8%)[a]	NA[b]
非脓肿	106/126(84.1%)	104/133(78.2%)	NA
国际（总计）	199/246(80.9%)	218/265(82.3%)	(-8.9%,4.2%)
脓肿	73/93(78.5%)	86/99(86.9%)	NA
非脓肿	126/153(82.4%)	132/166(79.5%)	NA

*盐酸莫西沙星与对照药之间的治愈率差异（盐酸莫西沙星 - 对照药）

a) 排除两名在最初48小时内需另行手术的患者

b) NA - 不适用

8、鼠疫

由于伦理学和可行性方面的原因，无法在肺鼠疫患者中开展盐酸莫西沙星的有效性研究。因此，这个适应症的批准是基于以动物为模型开展的一项有效性研究以及成人与动物的支持性药代动力学数据。

以患有肺鼠疫的非洲绿猴为动物模型，开展了一项随机、盲法、安慰剂对照研究。20只非洲绿猴（10只雄猴和10只雌猴）吸入平均剂量（± SD）为100±50 LD_{50}（范围为92-127 LD_{50}）的鼠疫耶尔森氏杆菌（CO92菌株）气雾剂。该研究中，莫西沙星对鼠疫耶尔森氏杆菌菌株的最小抑菌浓度（MIC）为0.06 mcg/mL。持续发热至少4个小时，将按照人体给药方案给予莫西沙星或安慰剂，进行10天治疗。在开始研究给药前，所有研究动物均发热，发生菌血症（鼠疫耶尔森氏杆菌）。治疗后83-139小时期间（平均115±19小时），接受安慰剂的10/10（100%）只动物死于疾病。在治疗结束后的30天内，莫西沙星治疗组的10/10（100%）只动物仍然存活。与安慰剂组相比，莫西沙星组的死亡率显著较低（生存率差异：100%，双侧检验95%精确置信区间为[66.3%，100%]，p<0.0001）。

在肺鼠疫的非洲绿猴模型中，与安慰剂组相比，莫西沙星组动物生存率改善具有统计学显著性，莫西沙星的平均血浆浓度达到或超过了口服和静脉给药方案的成人的药物血浆浓度。静脉滴注400mg莫西沙星的成人平均（±SD）峰浓度（Cmax）和总暴露量（AUC）分别为3.9±0.9mcg/mL和39.3±8.6 mcg·h/mL。采用人体给药方案模拟人体给药（剂量为400 mg）的非洲绿猴，在给药一天后莫西沙星的平均（±SD）峰浓度和AUC_{0-24}分别为4.4±1.5 mcg/mL和22±8.0 mcg·h/mL。

【药理毒理】

药理作用

（1）作用机制

莫西沙星是具有广谱活性和杀菌作用的8-甲氧基氟喹诺酮类抗菌药。莫西沙星在体外显示出对革兰阳性菌、革兰阴性菌、厌氧菌、抗酸菌和非典型微生物如支原体、衣原体和军团菌具有广谱抗菌活性。

杀菌作用机制为干扰拓扑异构酶Ⅱ和Ⅳ。拓扑异构酶是控制DNA拓扑和在DNA复制、修复和转录中关键的酶。

莫西沙星表现为浓度依赖性的杀菌活性，最低杀菌浓度和最低抑菌浓度基本一致。

莫西沙星对β-内酰胺类和大环内酯类耐药的细菌亦有效。通过感染的实验动物模型证实，莫西沙星体内活性高。

（2）耐药

导致对青霉素类、头孢菌素类、氨基糖苷类、大环内酯类和四环素类耐药的耐药机制不影响莫西沙星的抗菌活性。莫西沙星和这些抗菌药间无交叉耐药性。至今未发现质粒介导的耐药性出现。

莫西沙星的8-甲氧基部分与8-氢部分相比具有对革兰阳性菌高活性和耐药突变的低选择性。庞大的7位二氮杂环取代基能阻止主动外排，该主动外排为氟喹诺酮类药物的耐药机制。

体外试验显示经过多步变异才能缓慢地出现对莫西沙星的耐药性。总之其耐药率很低（10^{-7}～10^{-10}）。序列地将细菌暴露在低于莫西沙星MIC浓度时只能使MIC值有少量的增加。

与其他喹诺酮类药物之间存在交叉耐药。但是，一些对其他喹诺酮类药物耐药的革兰阳性菌和厌氧菌对莫西沙星敏感。

（3）对人类肠道菌群的作用

在两项志愿者口服盐酸莫西沙星的研究中观察到下列变化：大肠埃希菌，芽孢杆菌属，普通拟杆菌、肠球菌，克雷伯氏菌属和厌氧菌（如双歧杆菌、真杆菌和消化链球菌等）的减少，这些变化在两周内可以恢复正常，未发现艰难梭菌毒素。

（4）体外试验敏感数据

敏感	中度敏感	耐药
格兰阳性菌		
阴道加德菌		
肺炎链球菌，包括多重耐药肺炎链球菌菌株[MDRSP],包括已知的青霉素耐药菌株（PRSP),及对下述抗生素中两种或更多抗生素耐药菌株：青霉素（MIC≥2μg/ml)、第二代头孢菌素（如头孢呋辛）、大环内脂类、四环素类、甲氧苄啶/磺胺甲噁唑		
A组化脓链球菌*		
米氏链球菌		
轻型链球菌		
无乳链球菌		
停乳链球菌		
咽峡炎链球菌*		
星座链球菌*		
金黄色葡萄球菌（包括甲氧西林敏感菌株）*	金黄色葡萄球菌（甲氧西林/氧氟沙星耐药菌株）+	
科氏葡萄球菌		
表皮葡萄球菌（包括甲氧西林敏感菌株）	表皮葡萄球菌（甲氧西林/氧氟沙星耐药菌株）+	
溶血葡萄球菌		
人葡萄球菌		
腐生葡萄球菌		
模仿葡萄球菌		
白喉棒状杆菌		
粪肠球菌*（仅对万古霉素、庆大霉素敏感菌株）		

*/**已经证实能对敏感菌导致的已批准的临床适应症有效

+莫西沙星仅对由MecA基因介导的甲氧西林耐药葡萄球菌的体外MIC值在其敏感范围内。因此，如果发现这类菌株不推荐使用莫西沙星。

敏感	中度敏感	耐药
革兰阴性菌		
流感嗜血杆菌（包括产生和不产生β-内酰胺酶的菌株）*		
副流感嗜血杆菌*		
卡他莫拉菌（包括产生和不产生β-内酰胺酶的菌株）*		
百日咳博德特菌		
大肠埃希菌*		
肺炎克雷伯菌*		
产酸克雷伯菌		
产气肠杆菌		
成团肠杆菌		
阴沟肠杆菌*		
中间肠杆菌		
阪崎肠杆菌		
	铜绿假单胞菌	
	荧光假单胞菌	
	洋葱伯克霍尔德菌	
	嗜麦芽寡养单胞菌	
	奇异变形杆菌*	
普通变形杆菌		
摩氏摩根菌		
	奈瑟(氏)菌属**	
雷氏普罗威登斯菌		
斯氏普罗威登斯菌		

*/**已经证实能对敏感菌导致的已批准的临床适应症有效

敏感	中度敏感	耐药
厌氧菌		
吉氏拟杆菌		
埃氏拟杆菌		
脆弱拟杆菌*		
卵形拟杆菌		
多形拟杆菌*		
单形拟杆菌		
梭杆菌属		
消化链球菌属*		
卟啉单胞菌属		
厌氧卟啉单胞菌		
不解糖卟啉单胞菌		
大卟啉单胞菌		
普雷沃氏菌属		
丙酸杆菌属		
产气荚膜梭菌*		
多枝梭菌		
其他		
肺炎衣原体*		
沙眼衣原体**		
肺炎支原体*		
人（型）支原体		
支原（质）体		
嗜肺军团菌*		
伯氏考克斯氏体		

*/**已经证实能对敏感菌导致的已批准的临床适应症有效

对于某些细菌的获得性耐药率可能随地理和时间而改变。局部耐药是可能出现的，特别是治疗严重感染时。上述体外敏感试验结果可用来指导判断微生物是否对莫西沙星敏感。

单剂量静脉和口服给予0.4g盐酸莫西沙星的PK/PD比较。

需住院患者的AUC/MIC_{90}值大于125且C_{max}/MIC_{90}为8-10为临床治愈的期望值。门诊患者的参数值通常较低，AUC/MIC_{90}大于30-40。

下表为单剂量静脉和口服给予0.4g盐酸莫西沙星的PK/PD的计算值比较：

给药方式	静脉		口服	
参数（中位数）	AUIC[h]	C_{max}/MIC_{90} [a]	AUIC[h]	C_{max}/MIC_{90}
MIC_{90} 0.125 mg/L	313	32.5	279	23.6
MIC_{90} 0.25 mg/L	156	16.2	140	11.8
MIC_{90} 0.5 mg/L	78	8.1	70	5.9

a)1h输液

毒理研究

盐酸莫西沙星与其他喹诺酮类药物一样，毒性靶器官均为血液系统（犬及猴的骨髓细胞减少）、中枢神经系统（猴的惊厥）和肝脏（大鼠、犬及猴的肝酶升高、单细胞坏死），这些变化均于大剂量或长期使用盐酸莫西沙星后出现。

在犬体内进行的局部耐受性研究中，静脉注射盐酸莫西沙星后未出现局部不耐受的征象。经动脉内注射用药后，动脉周围软组织可见炎性变化，提示应避免经动脉内注射使用盐酸莫西沙星。

遗传毒性

Ames试验中4株（TA1535，TA1537，TA98和TA100）为阴性，中国仓鼠卵巢HPRT的突变试验和大鼠原发肝细胞的UDS试验也均为阴性。与其他喹诺酮类药物一样，盐酸莫西沙星对TA102的Ames试验为阳性，可能是由于其抑制拓扑异构酶。体外试验显示大剂量莫西沙星（300μg/ml）可导致中国仓鼠的V79细胞出现染色体异常，然而，小鼠体内微核试验为阴性结果。此外，体内试验测定其对小鼠的显性致死试验为阴性。总之，体内试验的结果充分反应了其体内的基因毒性。

生殖毒性

以大鼠、兔和猴进行的生殖毒性研究表明，盐酸莫西沙星可以通过胎盘。对大鼠（经口给药和静脉注射）和猴（经口给药）的研究表明，给予莫西沙星后未显示致畸作用和对生育力的损害。兔静脉给药20mg/kg可观察到骨骼畸形。该研究结果与已知的喹诺酮类药物对骨骼发育的影响一致。在人治疗浓度下，猴和兔的流产发生率增加。在大鼠，当经口给药剂量为使血药浓度在人治疗剂量范围内所推荐的最大药物剂量的63倍（按mg/kg体重计算）时，会出现胎鼠体重减少、流产增多、轻度延长孕期和一些雌性和雄性幼鼠自发活动增加等现象。

致癌性

虽然有关盐酸莫西沙星致癌作用的常规长期研究尚未进行，但该药进行了基因毒性体外和体内试验。此外，对大鼠进行了对于人类的致癌作用加速试验(诱癌/促癌试验)。在大鼠的诱癌/促癌试验中未发现其有致癌的证据。

光毒性

盐酸莫西沙星对光很稳定且潜在光毒性很低。体外试验和动物试验均显示盐酸莫西沙星的光毒性较其他喹诺酮类药物小。给予小鼠一些喹诺酮类药物并同时照射紫外线，这些喹诺酮类药物可增加紫外线的光致癌作用。尚未进行盐酸莫西沙星的光致癌作用研究，在志愿者的Ⅰ期研究中证实盐酸莫西沙星无潜在的光毒性。

心电图

高浓度的盐酸莫西沙星对心脏延迟整流钾电流有抑制作用，因此导致QT间期延长。犬经口给予大于90mg/kg莫西沙星进行毒理研究，导致血药浓度大于16mg/L，引起QT间期延长，但未出现心律失常。仅当累积静脉给药高于50倍人用剂量（>0.3g/kg）后，可导致血药浓度≥0.2g/L（高于静脉给药治疗浓度的30倍），可见可逆的非致命的室性心律失常。

眼毒性

大鼠和猴重复给药6个月毒性试验未见眼毒性。在犬试验中，给予高剂量（≥60mg/kg）时血浆浓度≥20mg/L，可引起视网膜电流图的变化，个别动物出现视网膜萎缩。

关节毒性

众所周知，喹诺酮类药物可以造成未成年实验动物的承重关节软骨的病变。可造成幼年犬的关节毒性的盐酸莫西沙星最小经口给药剂量是推荐最大治疗剂量（0.4g/50kg人体重）的4倍，其血药浓度比推荐治疗剂量时血药浓度高2-3倍。

【药代动力学】

1、吸收、分布、代谢、排泄

吸收

莫西沙星片口服后，在胃肠道中吸收良好。莫西沙星的绝对生物利用度为90%左右。莫西沙星与高脂餐（即脂肪中含500卡路里热量）同服时，不影响莫西沙星的吸收。

莫西沙星与1杯酸奶同服不会对全身吸收程度或吸收率（AUC）产生明显影响。

表12：单次或多次口服400mg莫西沙星后的C_{max}和AUC平均值（±标准差）

	C_{max} (mg/L)	AUC (mg·h/L)	半衰期 （小时）
单次口服给药 健康志愿者(n=372)	3.1±1	36.1±9.1	11.5-15.6[a]
多次口服给药			
健康的年轻男性/女性志愿者(n=15)	4.5±0.5	48±2.7	12.7±1.9
健康的老年男性志愿者(n=8)	3.8±0.3	51.8±6.7	
健康的老年女性志愿者(n=8)	4.6±0.6	54.6±6.7	
健康的年轻男性志愿者(n=8)	3.6±0.5	48.2±9	
健康的年轻女性志愿者(n=9)	4.2±0.5	49.3±9.5	

a) 不同研究的均值范围

表13：单次或多次1小时静脉滴注400mg莫西沙星后的C_{max}和AUC平均值（±标准差）

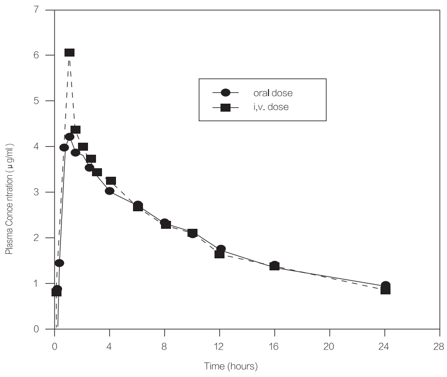
	C_{max} (mg/L)	AUC (mg·h/L)	半衰期 （小时）
单次静脉给药			
健康的年轻男性/女性志愿者(n=56)	3.9±0.9	39.3±8.6	8.2-15.4[a]
患者(n=118)			
男性(n=64)	4.4±3.7		
女性(n=54)	4.5±2		
<65 岁(n=58)	4.6±4.2		
≥65 岁(n=60)	4.3±1.3		
多次静脉给药			
健康的年轻男性志愿者(n=8)	4.2±0.8	38±4.7	14.8±2.2
健康的老年志愿者(n=12；8名男性，4名女性)	6.1±1.3	48.2±0.9	10.1±1.6
患者[b](n=107)			
男性(n=58)	4.2±2.6		
女性(n=49)	4.6±1.5		
<65 岁(n=52)	4.1±1.4		
≥65 岁(n=55)	4.7±2.7		

a)不同研究的均值范围

b)预期C_{max}（滴注结束时获得的浓度）

在最高供试剂量（单次口服1200mg）范围内，血药浓度与剂量成比例升高。血浆消除半衰期的平均时间（±标准差）为12±1.3小时；每日一次400mg给药时，至少在3天后达到稳态。

图1：每日一次口服400mg（n=10）或静脉滴注400mg（n=12）盐酸莫西沙星时获得的平均稳态血药浓度



分布

莫西沙星与血清蛋白的结合率约为30-50%，与药物浓度不相关。莫西沙星的分布容积在1.7-2.7L/kg之间。莫西沙星在体内广泛分布，组织浓度通常超过血药浓度。在口服或静脉滴注400mg莫西沙星后，已在唾液、鼻和支气管分泌物、窦粘膜、皮肤水疱液、皮下组织、骨骼肌肉和腹部组织和体液中检测到莫西沙星。口服或静脉滴注400mg莫西沙星后，各组织和体液中测得的莫西沙星浓度的总结见表14。莫西沙星从组织的消除速率通常与血浆消除速率相似。

表14：单次口服或静脉滴注400mg后，莫西沙星的组织浓度（平均值±标准差）和相应的血药浓度

组织和体液	N	血药浓度 (mcg/mL)	组织和体液浓度 (mcg/mL或mcg/g)	组织-血浆比值
呼吸系统				
肺泡巨噬细胞	5	3.3±0.7	61.8±27.3	21.2±10
支气管粘膜	8	3.3±0.7	5.5±1.3	1.7±0.3
上皮细胞衬液	5	3.3±0.7	24.4±14.7	8.7±6.1
鼻窦				
上颌鼻窦黏膜	4	3.7±1.1[b]	7.6±1.7	2±0.3
筛前粘膜	3	3.7±1.1[b]	8.8±4.3	2.2±0.6
鼻息肉	4	3.7±1.1[b]	9.8±4.5	2.6±0.6
皮肤，肌骨骼				
水疱液	5	3±0.5[c]	2.6±0.9	0.9±0.2
皮下组织	6	2.3±0.4[d]	0.9±0.3[e]	0.4±0.6
骨骼肌肉	6	2.3±0.4[d]	0.9±0.2[e]	0.4±0.1
腹腔				
腹部组织	8	2.9±0.5	7.6±2	2.7±0.8
腹部渗出物	10	2.3±0.5	3.5±1.2	1.6±0.7
脓液	6	2.7±0.7	2.3±1.5	0.8±0.4

a) 单次400mg给药后3小时，测定莫西沙星的所有浓度；但腹部组织和渗出物浓度除外，该浓度在给药后2小时测定，鼻窦浓度在第5日给药后3小时测定。

b) N=5

c) N=7

d) N=12

e) 只反映药物的非蛋白结合浓度。

代谢

大约52%的口服剂量或静脉给药剂量以葡萄糖苷酸和硫酸盐结合的形式进行代谢。细胞色素P450系统不参与莫西沙星的代谢，并且不受莫西沙星的影响。硫酸盐共轭物（M1）占莫西沙星给药剂量的38%，主要通过粪便排出。大约14%的口服剂量或静脉给药剂量被转换成葡萄糖苷酸共轭物（M2），并通过尿液排出。M2的血药峰浓度约为母体药物的40%，而M1的血药浓度通常不足莫西沙星浓度的10%。

细胞色素（CYP）P450酶的体外研究显示，莫西沙星不抑制CYP3A4、CYP2D6、CYP2C9、CYP2C19或CYP1A2。

排泄

大约45%的莫西沙星口服剂量和静脉给药剂量以原型药物排出（尿液中约20%，粪便中约25%）。共计96%±4%的口服剂量以原型药物或已知的代谢物形式排出。表观总体清除率和肾清除率的平均值（±标准差）分别为12±2 L/h和2.6±0.5 L/h。

2、对特定人群的药代动力学

老年人

16名健康的老年志愿者（8名男性；8名女性）和17名年轻的健康志愿者（8名男性；9名女性）在连续10天口服400mg莫西沙星后，莫西沙星的药代动力学未观察到年龄相关性变化。16名健康的男性志愿者（8名年轻人；8名老年人）单次口服200mg莫西沙星，年轻人与老年人的全身暴露程度（AUC和Cmax）未观察到统计学差异，消除半衰期保持不变。

不需根据年龄调整剂量。在大型的Ⅲ期研究中，在静脉滴注400mg莫西沙星后，老年患者在滴注结束时观察到的浓度与年轻患者相似。

儿童

尚未进行莫西沙星在儿童受试者体内的药代动力学研究。

性别

23名健康的男性受试者（19-75岁）和24名健康的女性受试者（19-70岁）每日一次口服400mg莫西沙星，连续服用10天之后，女性受试者的平均AUC和C_{max}分别比男性受试者高8%和16%。当考虑体重差异时，男性受试者与女性受试者的莫西沙星药代动力学未见显著差异。

对18名年轻的女性和男性进行一项单剂量400mg研究。该研究中（9名年轻女性和9名年轻男性），莫西沙星的药代动力学比较显示，性别未导致AUC或C_{max}出现差异。不需根据性别调整剂量。

种族

在每日一次口服400mg莫西沙星后，日本男性受试者的莫西沙星稳态药代动力学与高加索人相似，平均C_{max}为4.1 mcg/mL，AUC_{24}为47mcg·h/mL，消除半衰期为14小时。

肾功能不全

轻度、中度、重度或终末期肾病中，莫西沙星的药代动力学参数未出现明显变化。肾损害患者（包括需血液透析（HD）或连续卧床腹膜透析（CAPD）的患者）不需调整剂量。

在对肾功能从正常到重度损害的24名患者进行的一项单次口服给药研究中，中度（CL_{CR}≥30和≤60mL/min）和重度（CL_{CR}<30mL/min）肾损害患者的莫西沙星平均峰浓度（C_{max}）分别降低21%和28%。这些患者的平均全身暴露量（AUC）增加13%。在中度和重度肾损害患者中，硫酸盐共轭物（M1）的平均AUC增加了1.7倍（最高达2.8倍），葡萄糖苷酸共轭物（M2）的平均AUC和C_{max}分别增加了2.8倍（最高达4.8倍）和1.4倍（最高达2.5倍）。

对CL_{CR}<20mL/min的血液透析患者或连续卧床腹膜透析患者（8名血液透析患者，8名连续卧床腹膜透析患者）进行莫西沙星单次给药和多次给药，以研究药代动力学。在单次口服400mg莫西沙星后，这些血液透析和连续卧床腹膜透析患者的AUC与健康志愿者通常观察到的AUC相比，并不存在显著变化。血液透析和连续卧床腹膜透析患者的莫西沙星C_{max}值，与健康志愿者的历史对照相比，分别降低45%和33%左右。这些患者的硫酸盐共轭物（M1）暴露量（AUC）增加了1.4-1.5倍。与健康受试者相比，葡萄糖苷酸共轭物（M2）的平均AUC增加了7.5倍，而平均C_{max}值则增加了2.5-3倍。莫西沙星的硫酸盐和葡萄糖苷酸共轭物不具有生物活性，肾病患者（包括进行血液透析和连续卧床腹膜透析的患者）体内这些代谢物暴露量增加的临床意义尚未进行研究。

血液透析患者或连续卧床腹膜透析患者每日一次口服400mg盐酸莫西沙星，连续服用7天后，莫西沙星的平均全身暴露量（AUCss）与健康志愿者通常观察到的平均全身暴露量相似。血液透析患者的稳态C_{max}值比连续卧床腹膜透析患者低22%左右，但后者与健康志愿者具有可比性。血液透析和连续卧床腹膜透析只从体内排出少量的莫西沙星，分别为9%和3%左右。血液透析和连续卧床腹膜透析分别排出约4%和2%的葡萄糖苷酸代谢物（M2）。

肝功能不全

轻度、中度肝功能不全（Child-PughA、B级）不需调整剂量。不过，与肝功能不全相关的代谢紊乱可能会引起QT间期延长，这些患者应慎用本品。

6名轻度肝功能不全（Child-PughA级）患者和10名中度肝功能不全（Child-PughB级）患者单次口服400mg莫西沙星后，莫西沙星的平均全身暴露量（AUC）分别为18名健康对照者的78%和102%，平均峰浓度（C_{max}）分别为对照者的79%和84%。

轻度肝功能不全组和中度肝功能不全组的莫西沙星硫酸盐共轭物的平均AUC分别增加了3.9倍（最高达5.9倍）和5.7倍（最高达8倍）。两组的M1 C_{max}平均增加了3倍左右（最高达4.7倍和3.9倍）。两组的莫西沙星葡萄糖苷酸共轭物（M2）的平均AUC增加了1.5倍（最高达2.5倍）。M2的平均C_{max}分别增加了1.6倍和1.3倍（最高达2.7倍和2.1倍）。硫酸盐和葡萄糖苷酸共轭物暴露量增加的临床意义尚未进行研究。在一些参与临床试验的患者中，Child-Pugh C级患者（n=10）在首次静脉滴注或口服本品后莫西沙星达峰时间左右测得的莫西沙星及其代谢物的血药浓度与Child-PughA/B级患者（n=5）相似；此外，也与健康志愿者研究观察到的血药浓度相似。

潜在光敏感性

对32名健康志愿者（每组8名）进行一项紫外线（UVA和UVB）和可见光辐射引起的皮肤反应研究。该研究证实，本品与安慰剂相比，并不显示光毒性。在本品（200mg或400mg，每日一次）、洛美沙星（400mg，每日一次）或安慰剂给药前后，测定最小红斑剂量（MED）。在该研究中，本品的两种给药剂量测得的最小红斑剂量与安慰剂相比，不具有显著差异；而洛美沙星则显著降低了最小红斑剂量。

患者实际使用过程中，很难确定各种不同氟喹诺酮类药物之间相对光敏感性/光毒性的产生原因，因为其他因素在确定受试者是否易发生该不良事件方面也起着重要作用：患者的皮肤色素沉着、日晒和人工紫外光暴露的频率和时间、涂抹防晒霜和穿上保护服、伴随使用其他药物、氟喹诺酮类药物的用量和持续时间。

3、药物-药物相互作用

已对健康志愿者或患者用药中的下列药物相互作用进行了研究。

与其他喹诺酮类药物观察到的一样，抗酸药和铁明显降低了莫西沙星的生物利用度。

钙、地高辛、伊曲康唑、吗啡、丙磺舒、雷尼替丁、茶碱和华法林不会对莫西沙星的药代动力学产生显著影响。体外研究的这些结果和数据表明，莫西沙星可能不会显著更改经CYP3A4、CYP2D6、CYP2C9、CYP2C19或CYP1A2酶代谢的药物代谢清除率。

莫西沙星不会对阿替洛尔、地高辛、格列本脲、伊曲康唑、口服避孕药、茶碱、环孢菌素和华法林的药代动力学产生具有临床意义的显著影响。

抗酸药

12名健康志愿者在服用含铝/镁的抗酸药（900mg氢氧化铝和600mg氢氧化镁，用作单次口服）2小时前、伴随使用或服用抗酸药4小时后口服莫西沙星（单次口服400mg片剂），莫西沙星的平均AUC分别降低26%、60%和23%。应在服用含镁或铝的抗酸药、硫糖铝、金属阳离子（如铁）以及含锌的多种维生素制剂或去羟肌苷咀嚼片/缓释片或小儿口服颗粒至少4小时前或8小时后服用莫西沙星片。

阿替洛尔

在一项纳入24名健康志愿者（12名男性；12名女性）的交叉研究中，单次口服50mg阿替洛尔联合安慰剂给药后，阿替洛尔的平均AUC与单次口服400mg莫西沙星联合阿替洛尔给药所观察到的平均AUC相似。联合给予单剂量莫西沙星后，单剂量阿替洛尔的平均Cmax降低10%左右。

钙

12名健康志愿者伴随给予莫西沙星（400mg单剂量给药）和钙（500mg Ca++膳食补充剂单剂量给药），再在莫西沙星给药后12小时和24小时加用两剂钙。钙未对莫西沙星的平均AUC产生任何显著影响。莫西沙星与钙联合给药的平均Cmax略低于莫西沙星单独给药，而血药浓度达峰时间略长于莫西沙星单独给药（分别为2.5小时和0.9小时）。这些差异不被视为具有临床意义。

地高辛

在一项纳入12名健康志愿者的研究中，未见莫西沙星（400mg，每日一次，连用2天）对地高辛（0.6mg，单剂量给药）的AUC产生任何显著影响。地高辛分布相期间，地高辛的平均C_{max}增加了50%左右。地高辛C_{max}的突然增加并不被视为具有临床意义。莫西沙星联合地高辛给药或莫西沙星单独给药情况下，莫西沙星的药代动力学相似。莫西沙星与地高辛伴随给药时，不需调整莫西沙星或地高辛的剂量。

格列本脲

对于糖尿病患者，格列本脲联合莫西沙星给药（400mg每日一次，连用5天）时，格列本脲（2.5mg每日一次，连续两周，作为预治疗；随后连续5天合并用药）的平均AUC和C_{max}分别比格列本脲联合安慰剂给药低12%和21%。不过，接受格列本脲联合莫西沙星给药的患者与接受格列本脲单独给药的患者相比，血糖水平略微降低，这表示莫西沙星不干扰格列本脲的活性。不认为这些相互作用结果具有临床意义。

铁

莫西沙星片剂与铁（硫酸亚铁100mg，每日一次，连用两天）联合给药时，莫西沙星的平均AUC和C_{max}分别降低39%和59%。因此，本品应在服用铁制剂4小时前或8小时后给药。

伊曲康唑

在一项纳入11名健康志愿者的研究中，未见伊曲康唑（CYP450酶3A4的一种强效抑制剂，200mg每日一次，连用9天）对莫西沙星（在伊曲康唑给药第7天单次给予400mg莫西沙星）的药代动力学产生任何显著影响。此外，研究显示，莫西沙星不会影响伊曲康唑的药代动力学。

吗啡

在一项纳入20名健康的男性和女性志愿者的研究中，未观察到硫酸吗啡（单次肌内注射10mg）对莫西沙星（400mg单次给药）的平均AUC和C_{max}产生任何显著影响。

口服避孕药

一项纳入29名健康女性受试者的安慰剂对照研究显示，400mg莫西沙星，每日一次，连用7天，不会干扰含0.15mg左炔诺孕酮/0.03mg炔雌醇的口服避孕药的激素抑制（经血清孕酮、FSH、雌二醇和LH的测定）或干扰避孕药的药代动力学。

丙磺舒

在一项纳入12名健康志愿者的研究中，丙磺舒（500mg，每日两次，连用2天）不改变莫西沙星（400mg单次给药）的肾清除率以及经肾排出的莫西沙星总量。

雷尼替丁

在一项纳入10名健康志愿者的研究中，未见雷尼替丁（150mg，每日两次，连用3天，作为预治疗）对莫西沙星（400mg单次给药）的药代动力学产生任何显著影响。

茶碱

在一项纳入12名健康志愿者的研究中，未见莫西沙星（200mg，每12小时1次，连用3天）对茶碱（400mg，每12小时1次，连用3天）的药代动力学产生任何显著影响。此外，研究显示，茶碱不会影响莫西沙星的药代动力学。400mg莫西沙星与茶碱联用的作用尚未研究。

华法林

在一项纳入24名健康志愿者的研究中，未见莫西沙星（400mg，每日一次，连用8天）对R-和S-华法林（第5日单次给予25mg华法林钠）的药代动力学产生任何显著影响。凝血酶原时间未观察到任何显著变化。

4、中国人药代动力学研究

单剂量给药：10名健康受试者按拉丁方设计，随机分为3组（第一组3人，第二组3人，第三组4人），分别交叉给药0.2g、0.3g、0.4g莫西沙星，输液时间均为90分钟，每次试验间隔为7天。（注：国外盐酸莫西沙星氯化钠注射液的输液时间为30-60分钟不等。根据中国健康受试者心脏所能耐受的输液速率计算出盐酸莫西沙星氯化钠注射液在试验中的输液时间为90分钟。）

所得药时曲线均较好地符合二房室模型。具体参数如下：

	C_{max}(mg/L)	AUC_{0-96}(mg*h/L)	剂量比	C_{max}比	AUC_{0-96}比
0.2g	2.528±0.191	32.642±2.754	1：1.5：2	1：1.5：2.05	1：1.48：2
0.3g	3.782±0.333	48.433±3.227			
0.4g	5.178±0.176	65.189±4.965			

多剂量给药：10名健康受试者每日一次静脉滴注莫西沙星0.4g，连续输注10天。

血药浓度约在第4天达稳态。达稳态后的平均峰浓度为5.351±0.533mg/L，平均谷浓度为1.084±0.177mg/L，经计算后波动系数为1.39。稳态后AUC_{ss0-24}与第一次服药后的$AUC_{0-\infty}$无显著性差异。半衰期约为14小时，表明连续给药10天后药物在体内无蓄积。

中国人药代动力学试验结果与国外文献报告相比，其峰浓度有差异，原因主要是静脉输液速率不同所致，而药物的分布及消除过程基本一致。

【贮藏】

遮光，密闭，15℃～30℃保存。

在原包装中贮存，不要冷藏或冷冻。冷藏（2～8℃可发生沉淀），室温下可再溶解。因此建议不要将盐酸莫西沙星氯化钠注射液贮藏在冰箱中。

将药品置于儿童触及不到的地方。

【包装】三层共挤输液用袋。250ml/袋。

【有效期】24个月

【执行标准】YBH00482020

【批准文号】国药准字H20203073

【上市许可持有人及生产企业名称】 南京正大天晴制药有限公司

【上市许可持有人及生产企业地址】 南京经济技术开发区惠欧路9号

邮政编码：210038
电话号码：025-85109999
传真号码：025-85803122
网　　址：www.njcttq.com

南京正大天晴制药有限公司
NANJING CHIA TAI TIANQING PHARMACEUTICAL CO., LTD.