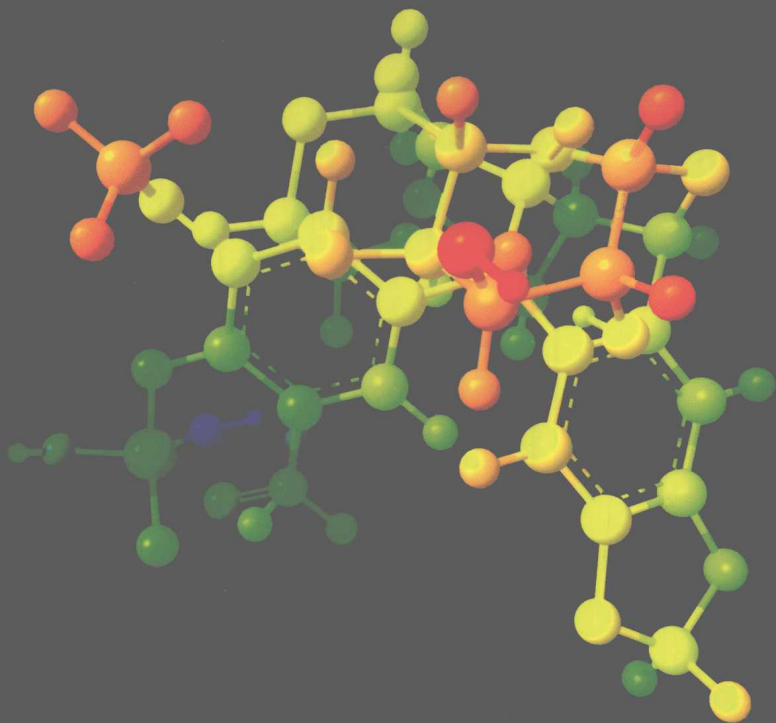


商品名
化学结构
化学名称
性状
CA登录号
化学文摘号
专利号
知识产权状况
首创厂商
首次上市国家及时间
适应证
剂型规格
用法用量
药理作用
药动学
临床评价
不良反应
注意事项
参考文献



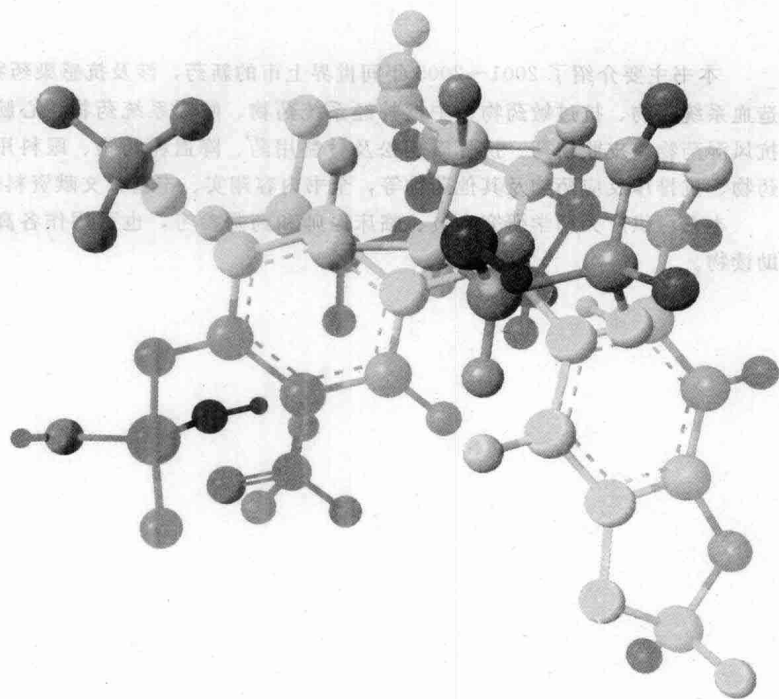
New Approved Drugs in the World

世界上市新药 2

汪啸洋 主编



化学工业出版社
生物·医药出版分社



New Approved Drugs
the World

世界上市新药2

汪啸洋 主编



化学工业出版社
生物·医药出版分社
·北京·

本书主要介绍了 2001~2005 年间世界上市的新药, 涉及抗感染药物、抗肿瘤药物、血液与造血系统药物、抗过敏药物、中枢神经系统药物、呼吸系统药物、心脑血管系统药物、抗炎与抗风湿药物、皮肤用药、抗骨质疏松及骨骼用药、降血糖药物、眼科用药物、生殖及泌尿系统药物、抗排斥反应药物及其他药物等, 全书内容翔实、丰富, 文献资料较新、价值高。

本书可供广大药学研究人员、临床医师和药师参考, 也可用作各高等院校相关专业教学辅助读物。

图书在版编目(CIP)数据

世界上市新药 2/汪啸洋主编. —北京: 化学工业出版社,
2010. 5
ISBN 978-7-122-08134-6

I. 世… II. 汪… III. 新药-汇编 IV. R97

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2010) 第 056141 号

责任编辑: 陈燕杰 孙小芳 余晓捷
责任校对: 吴 静

文字编辑: 李 瑾
装帧设计: 张 辉

出版发行: 化学工业出版社 生物·医药出版分社
(北京市东城区青年湖南街 13 号 邮政编码 100011)

印 刷: 北京永鑫印刷有限责任公司

装 订: 三河市万龙印装有限公司

720mm×1000mm 1/16 印张 24 字数 496 千字 2010 年 8 月北京第 1 版第 1 次印刷

购书咨询: 010-64518888 (传真: 010-64519686) 售后服务: 010-64518899

网 址: <http://www.cip.com.cn>

凡购买本书, 如有缺损质量问题, 本社销售中心负责调换。

定 价: 95.00 元

版权所有 违者必究

本书编写人员

主 编	汪啸洋			
副 主 编	高 署	汪小润		
编写人员	汪啸洋	高 署	汪小润	
	章 媛	邹丽云	檀雅昱	

前 言



科学技术的发展、多学科交融为药学研究开创了药物创新的广阔空间,近年来,随着人们对健康的关注和追求,更加推动了新药的研制,相关报道和文献资料令人目不暇接。2006年本人编写出版了《世界上市新药》一书,向读者介绍了1996~2000年间国外制药企业研制成功上市的100多种新药。该书与读者见面以来,受到广大药学研究人员和临床医师、药师的肯定和欢迎。能为新药应用提供信息和借鉴,为我国新药研制提供基本的资料这使本人深感慰藉和鼓舞,也使继续这项工作有了意义和价值。在同行和亲朋的支持和鼓励下,本人继续编写了本书,介绍了2001~2005年间世界上市的新药。由于介绍国外上市新药的资料来源较少,涉及面广、专业性强、资料收集整理工作量大,对文献领会、把握专业知识要求较高,致使编写进展较慢。经过不懈努力,2001~2005年间世界上市的164种新药已编写完成,本次编写格式与前5年基本相同,但在内容上更注重药理学类国外重要的杂志文献,如“Drugs”、“Drugs of the Future”、“Drugs Today”等药物研究权威杂志,以及国内介绍新药的《中国新药杂志》、《世界临床药物》等杂志上相关文献的参考和资料收集,以希望为读者提供最新可靠和有价值的信息资料。可以看出,由于药品的特殊性,近年来,新药的研制并没有像其他产品那样大幅度增长,相反,从数量上看似乎减缓了上市的进程,可见药学科工作者在新药研制过程中更加艰辛,各国药品管理部门对新药上市审批也更严格。

书中收录的每种药物,其中、英文名称均与中华人民共和国卫生部药典委员会编制的《中华人民共和国药典》(2010年版)、《中国药品通用名称》(化学工业出版社出版)相一致。有不少药物的中、英文名称来自中华人民共和国卫生部药典委员会的资料。

在资料收集、编写过程中,得到了专家的鼓励 and 家人的支持帮助,中国药科大学研究生章媛、邹丽云、檀雅昱等承担了文献查阅、整理、编写等工作,在此一并表示感谢。

虽然有前次编写的经验,但在对大量资料进行阅读、理解和整理的过程中,由于作者水平有限,疏漏之处在所难免,恳请同行读者提出宝贵意见。

交稿之际秋色正浓,很高兴能获得这份收获的喜悦,尽管继续做下去还是那般枯燥与艰辛,就让我们保持这愉悦的心态,乘风前行!

汪啸洋
2010年2月

目 录



抗感染类药物

1

阿德福韦酯 Adefovir Dipivoxil	1
艾他培南钠 Ertapenem Sodium	3
巴洛沙星 Balofloxacin	6
白百破-脊髓灰质炎疫苗加强剂 DTP-polio vaccine booster	8
白喉-破伤风-百日咳-脊髓灰质炎疫苗加强剂 DTPa + IPV booster	9
甲、乙型肝炎联合疫苗倍尔来福 Hepatitis A and B Combined Vaccine	10
泊沙康唑 Posaconazole	12
多立培南 Doripenem	14
恩夫韦肽 Enfuvirtide	17
恩曲他滨 Emtricitabine	20
恩替卡韦 Entecavir	22
伏立康唑 Voriconazole	25
福沙普那韦钙盐 Fosamprenavir Calcium	28
富马酸替诺福韦酯 Tenofovir disoproxil fumarate	31
甲肝-伤寒多聚糖的疫苗 Viatim	34
卡泊芬净 Caspofungin	35
抗白喉-破伤风-百日咳疫苗(吸附) Daptacel	38
磷氟康唑 Fosfluconazole	40
流感疫苗 Influenza	41
硫酸阿扎那韦 Atazanavir Sulfate	43
轮状病毒疫苗 Rotavirus Vaccine	45
米卡芬净钠 Micafungin Sodium	47
脑膜炎 C 疫苗 NeisVac-C	49
脑膜炎奈瑟菌疫苗 Meningococcal B Vaccine	51
帕珠沙星 Pazufloxacin	51
培干扰素 α -2a PEG-interferon alfa-2a	54
普卢利沙星 Prulifloxacin	56
伤寒疫苗 Typhoid	59
水痘带状疱疹免疫球蛋白 Varicella zoster immuno globulin	59

替吉环素 Tigecycline	61
替利霉素 Telithromycin	64
缙更西洛韦 Valganciclovir	67

抗肿瘤药物及辅助药 70

氨基乙酰丙酸甲酯 Methyl Aminolevulinate	70
阿巴瑞里克 Abarelix	72
阿加糖酶 α Agalsidase Alfa	74
阿加糖酶 β Agalsidase Beta	76
阿仑珠单抗 Alemtuzumab	78
阿瑞吡坦 Aprepitant	80
贝伐单抗 Bevacizumab	83
贝洛替康 Belotecan	85
氟维雌烯醇 Fulvestrant	87
黑素瘤疫苗 Melanoma Vaccine	90
吉非尼布 Gefitinib	90
甲磺酸伊马替尼 Imatinib Mesylate	93
今又生 Gendicine	95
氯法拉滨 Clofarabine	97
洛铂 Lobaplatin	99
培非司亭 Pegfilgrastim	102
培美曲塞二钠 Pemetrexed Disodium	103
硼替佐米 Bortezomib	106
索拉非尼 Sorafenib	109
他拉泊芬钠 Talaporfin Sodium	112
他米巴罗汀 Tamibarotene	114
替莫泊芬 Temoporfin	116
替伊莫单抗 Ibritumomab Tiuxetan	118
托西莫单抗 ^{131}I -Tositumomab	121
维如利金 Virulizin	123
西妥昔单抗 Cetuximab	124
氧化型谷胱甘肽 NOV-002	127
盐酸埃罗替尼 Erlotinib Hydrochloride	128
盐酸氨柔比星 Amrubicin Hydrochloride	131
盐酸帕洛诺司琼 Palonosetron Hydrochloride	133
盐酸吲哚司琼 Indisetrone Hydrochloride	135

血液与造血系统药物 138

5-阿扎胞苷 5-Azacitidine	138
牛血红蛋白多聚体 Hemoglobin Glutamer-250	140
达依泊汀 α Darbepoetin Alfa	141
拉布立酶 Rasburicase	144
屈曲可近 α Drotrecogin Alfa	146
人活化C蛋白 CTC-111	148
戊聚糖钠 Fondaparinux Sodium	149
希美加群 Ximelagatran	151
血友病凝血因子VIII Factor VIII	154

抗过敏药物 157

地洛他定 Desloratadine	157
卢帕他定 Rupatadine	159
马来酸替加色罗 Tegaserod Maleate	162
盐酸左西替利嗪 Levocetirizine Hydrochloride	165

中枢神经系统药物 168

阿立哌唑 Aripiprazole	168
艾司西酞普兰 Escitalopram	171
艾司佐匹克隆 Eszopiclone	173
夫罗曲普坦 Frovatriptan	176
甲磺酸雷沙吉兰 Rasagiline Mesylate	178
雷美替胺 Ramelteon	181
哌罗匹隆 Perospirone	184
普瑞加巴林 Pregabalin	186
齐考诺肽 Ziconotide	189
羟丁酸钠 Sodium Oxybate	192
盐酸阿托西汀 Atomoxetine Hydrochloride	194
盐酸度洛西汀 Duloxetine Hydrochloride	196
依达拉奉 Edaravone	198
依来曲普坦 Eletriptan	200
右哌甲酯 Dexmethylphenidate	203

呼吸系统药物 205

α_1 -蛋白酶抑制剂 Alpha1-Proteinase Inhibitor (Human)	205
奥马珠单抗 Omalizumab	207

波生坦 Bosentan	209
夫多司坦 Fudosteine	211
环索奈德 Ciclesonide	213
甲磺酸吉米沙星 Gemifloxacin Mesylate	216
噻托溴铵 Tiotropium Bromide	218
西维利司他 Sivelestat	221

心脑血管系统药物 224

阿折地平 Azelnidipine	224
奥美沙坦酯 Olmesartan Medoximil	227
罗苏伐他汀钙 Rosuvastatin Calcium	230
奈西立肽 Nesiritide	233
匹伐他汀钙 Pitavastatin Calcium	236
曲前列尼尔钠 Treprostinil Sodium	238
盐酸兰地洛尔 Landiolol Hydrochloride	241
依普利酮 Eplerenone	243
依折麦布 Ezetimibe	246
佐芬普利 Zofenopril	248

抗炎、抗风湿药物 252

阿达木单抗 Adalimumab	252
阿那白滞素 Anakinra	254
伐地考昔 Valdecoxib	257
芦米考昔 Lumiracoxib	259
帕瑞昔布 Parecoxib	261
依托考昔 Etoricoxib	263

皮肤用药物 266

阿来法塞 Alefacept	266
吡美莫司 Pimecrolimus	268
重组人表皮生长因子 DWP-401	270
达托霉素 Daptomycin	272
那他利单抗 Natalizumab	275
曲弗明 Trafermin	276
依法利珠 Efalizumab	277

抗骨质疏松及骨骼用药物 280

成骨蛋白-1 OP-1 Implant	280
---------------------------	-----

地波特明 α	Dibotermine Alfa	281
氟骨三醇	Falecalcitriol	282
雷奈酸锶	Strontium Ranelate	285
奈立膦酸	Neridronic Acid	287
司凯利特	Skelite	289
特立帕肽	Teriparatide	289

降血糖药物 292

艾塞那肽	Exenatide	292
地特胰岛素	Insulin Detemir	294
咪替利尼特	Mitiglinide	296
普兰林肽	Pramlintide	299
猪促胰液素	Porcine Secretin	301

眼科用药物 304

比马前列素	Bimatoprost	304
培加尼布钠	Pegaptanib Sodium	306
曲伏前列素	Travoprost	309

生殖及泌尿系统药物 312

重组促黄体素 α	Lutropin α , recombinant	312
重组绒促性素 α	Chorionadotropin- α , recombinant	313
达非那新	Darifenacin	315
度他雄甾酯	Dutasteride	317
伐地那非	Vardenafil	320
索非那新	Solifenacin Succinate	323
他达非尔	Tadalafil	325

抗排斥反应药物 329

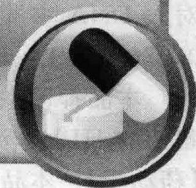
麦考酚酸钠	Mycophenolic Acid Sodium	329
依维莫司	Everolimus	331

其他药物 334

B型肉毒毒素	Botulinum Toxin Type B	334
地高辛抗体	Digoxin Antibody	335
地拉罗司	Deferasirox	337

戈硫酯酶	Galsulfase	339
拉罗尼酶	Laronidase	341
磷酸钠	Sodium Phosphate	342
抗响尾蛇分泌的毒素 Fab	Crotalidae polyvalent immune Fab ovine	344
麦格司他	Miglustat	346
尼替西酮	Nitisinone	348
哌氟群	Perflutren	350
培氟仙	Perflexane	352
培维索孟	Pegvisomant	354
普拉莫瑞林	Pralmorelin	356
四氢大麻酚：大麻二酚	THC：CBD	358
碳酸镧	Lanthanum Carbonate	359
铁竣葡胺	Ferucarbotran	362
托珠单抗	Tocilizumab	363
盐酸西那卡塞	Cinacalcet Hydrochloride	364
中文索引		368
英文索引		371

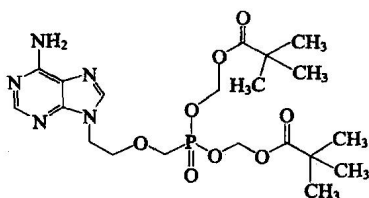
抗感染类药物



阿德福韦酯 Adefovir Dipivoxil

【商品名】 Hepsera, Preveon

【化学结构】



分子式: $C_{20}H_{32}N_5O_8P$ 相对分子质量: 501.48

【化学名称】

[2-(6-氨基嘌呤-9-基)乙氧基甲基-(2,2-二甲基丙酰氧基甲氧基)膦酰基]氧甲基 2,2-二甲基丙酸酯

[2-(6-aminopurin-9-yl) ethoxymethyl-(2, 2-dimethylpropanoyloxymethoxy) phosphoryl]oxymethyl 2,2-dimethylpropanoate

【性状】 白色或灰白色晶体粉末, 水溶度为 19mg/mL (pH: 2.0)、0.4mg/mL (pH: 7.2)。辛醇/水分配系数为 1.91 (pH: 7)。

【CA 登录号】 [142340-99-6]

【化学文摘号】 CA 136: 379492

【专利号】 EP 205826

【知识产权状况】 专利优先权日: CS 850425。

【首创厂商】 美国 Gilead Sciences 公司, Glaxo Smith Kline 公司。

【首次上市国家及时间】 2002 年 9 月 20 日首次在美国上市。

【适应证】 抗病毒, 治疗慢性乙型肝炎病毒感染。

【剂型规格】 片剂: 每片含本品 10mg。

【用法用量】 口服, 每日一次, 每次 10mg。

【药理作用】 本品为逆转录酶抑制剂, 是阿德福韦的前体药物, 在体内转化为阿德福韦发挥抗病毒作用。阿德福韦是一种单磷酸腺苷的无环核苷酸类似物, 在体内通



抗感染类药物



过细胞激酶作用被磷酸化为具有活化作用的二磷酸阿德福韦，二磷酸阿德福韦抑制 HBV DNA 多聚酶或逆转录酶的作用机制是：竞争脱氧腺苷三磷酸底物或终止病毒 DNA 链延长。二磷酸阿德福韦对 HBV DNA 多聚酶的抑制常数为 0.1mmol/L ；对人 DNA 多聚酶 α 、 γ 的抑制作用较弱，其抑制常数分别为 1.18mmol/L 和 0.97mmol/L ，因此治疗剂量对正常细胞没有毒性。

本品抑菌系数 K_i 为 $0.1\mu\text{mol/L}$ ， EC_{50} 为 $0.2\sim 0.25\mu\text{mol/L}$ 。本品对拉米夫定耐药的 HBV、泛昔洛韦耐药株敏感，且无致畸胎致癌毒性。

【药动学】 本品的生物利用度约 59%。慢性乙肝患者口服本品 10mg ， C_{max} 为 $(18.4\pm 6.26)\text{ng/mL}$ ， T_{max} 为 $0.58\sim 4.00\text{h}$ ， $\text{AUC}_{0\sim\infty}$ 为 $(220\pm 70.0)\text{ng}\cdot\text{h/mL}$ ；食物对其无影响。

每天静脉给药 1.0mg/kg 或 3.0mg/kg ，分布体积分别为 $(392\pm 75)\text{mL/kg}$ 、 $(352\pm 9)\text{mL/kg}$ 。

本品半衰期 $t_{1/2}$ 为 $(7.84\pm 1.65)\text{h}$ ，口服后本品 45% 迅速代谢为阿德福韦，多经肾小球滤过和肾小管主动分泌相结合的方式通过肾脏由尿原型排泄。

【临床评价】 在对 HBeAg 阳性、ALT 异常或正常的二项双盲、安慰剂对照的 II 期临床试验中，ALT 异常患者每天接受本品 5mg 、 30mg 或 60mg ，治疗 12 周后， 5mg 剂量组血清 HBV DNA 较基线下降 $1\lg$ ， 30mg 和 60mg 剂量组血清 HBV DNA 较基线下降 $3\sim 4\lg$ ，而安慰剂组无显著变化。36 周后， 30mg 和 60mg 剂量组 HBeAg 转阴率为 27%，HBeAg 血清转化率为 20%，且血清转化率增高与基线时 ALT 水平呈正相关。而 ALT 正常患者每天接受本品 30mg ，治疗 12 周后，血清 HBV DNA 较基线下降 $3\lg$ 。

在一项有 515 例患者的随机、双盲、安慰剂对照临床试验中，在前 48 周，患者被随机分组，173 例患者服用阿德福韦 30mg 、172 例患者服用阿德福韦 10mg 、170 例服用安慰剂；48 周后，阿德福韦 30mg 组接受安慰剂治疗至 96 周， 10mg 组再次随机按 1:1 接受安慰剂或继续使用阿德福韦 10mg 治疗至 96 周，而安慰剂组接受阿德福韦 10mg 治疗至 96 周。全部患者在第一次随机前 6 个月内接受第一次肝活检，在治疗 48 周、96 周后接受第二、第三次肝活检。结果显示，治疗 48 周后，阿德福韦 10mg 、 30mg 组组织学改善率分别为 53% 和 59%，显著高于安慰剂组 25%； 10mg 和 30mg 剂量组治疗后血清 HBV DNA 较基线时下降 $3.52\lg$ 和 $4.76\lg$ ，而安慰剂组为 $0.55\lg$ ； 10mg 剂量组 HBeAg 血清转化率为 12%，HBeAg 阴转率为 24%，ALT 复常率为 48%，而安慰剂组分别为 11%、6% 和 16%。

72 例 CD_4 细胞数在 $200\sim 500/\text{mm}^3$ 范围和 HIV RNA 大于 10000 拷贝数/mL 的 HIV 感染者，服用本品 $125\text{mg}/\text{天}$ 治疗，每日 1 次，持续 6 周，接着再进行 6 周的本品开标治疗。结果显示本品耐受性较好，未出现明显的与药物相关的毒性，患者的 CD_4 细胞数变化为 +46（安慰组为 -31），血清 HIV RNA 的平均 $\lg$ 值变化为 -0.5（安慰组无变化），可见本品对 HIV 感染症患者有良好疗效。

【不良反应】 常见的不良反应有恶心、腹痛、腹胀、腹泻、消化不良、乏力、头痛、头重感等症状。本品具有肝毒性，可造成肝肿大，检查值异常有 ALT、AST >5 倍正常值上限，肌酸激酶 >4 倍正常值上限，血淀粉酶 >2 倍正常值上限；剂量 >30mg 时可出现肾功能损害，<10mg 发生率较低；可引起乳汁酸毒症。

【注意事项】 对本品任一成分过敏者禁用，12 岁以下患者禁用；孕妇、哺乳期妇女慎用；肾功能不全及受损者需遵医嘱减少剂量并进行监测。

要严格遵照处方全程服药，不能随便停药，否则会加重病情；停药后 12 周内可能引起严重感染（发生率 25%），需定期检查。

本品不能抑制肝炎病毒传染，因此仍要防止其通过体液或血液传播。

与异布洛芬联用，将提高本品的生物利用度， C_{max} 、AUC、尿排泄量增加。因此联用时需密切监测并及时调整剂量。

【参考文献】

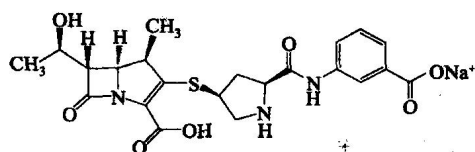
- [1] 茅益民，曾民德．抗乙型病毒性肝炎新药——阿德福韦酯．中华肝脏病杂志 2004，12（1）：61-63.
- [2] Ann I Graul. The Year's New Drugs. Drug News Perspect, 2003, 16（1）：Jan.-Feb.
- [3] Prous J, Graul A, Castaner J. Adefovir dipivoxil. Drugs of the Future, 1997, 22（8）：825.
- [4] Nobel S, Goa K L. Adefovir dipivoxil. Drugs, 1999, 58：479-487.
- [5] Dai C Y, Chuang W L, et al. Adefovir dipivoxil treatment of lamivudine-resistant chronic hepatitis B. Antiviral Research, 2007, 75（2）：146-151.
- [6] http://www.fda.gov/medwatch/safety/2006/Sep_PIs/Hepsera_PI.pdf.



艾他培南钠 Ertapenem Sodium

【商品名】 Invanz

【化学结构】



分子式： $C_{22}H_{24}N_3NaO_7S$ 相对分子质量：497.50

【化学名称】

(1R,5S,6S)-2-[2(S)-[N-(3-羧基苯基)氮甲酰基]吡咯烷-4(S)-基硫]-6-[1(R)-羟乙基]-1-甲基-1-碳杂-2-青霉烯-3-羧酸单钠盐

(1R,5S,6S)-2-[2(S)-[N-(3-carboxyphenyl) carbamoyl]pyrrolidin-4(S)-ylsul-

fanyl]-6-[1(R)-hydroxyethyl]-1-methyl-1-carba-2-penem-3-carboxylic acid monosodium salt

【性状】 无色至白色微结晶型粉末，有吸湿性，溶于水和生理盐水，部分溶解于乙醇，不溶于醋酸异丙酯和四氢呋喃。

【CA 登录号】 [153832-38-3]

【化学文摘号】 CA 137: 72412

【专利号】 WO 9315078, US 5478820

【知识产权状况】 专利优先权日: CS 920204。

【首创厂商】 英国 Astra Zeneca 公司发现，美国 Merck 公司获许可。

【首次上市国家及时间】 2002 年 2 月首次在美国上市。

【适应证】 适用于中至重度敏感菌引起的感染，包括复杂的腹腔内感染、皮肤软组织及皮肤附件感染、肺炎、复杂的尿路感染、肾盂肾炎、急性盆腔炎及妇科感染。

【剂型规格】 冻干粉针剂：每瓶含本品 1.046g（相当于艾他培南 1g）。

【用法用量】 静脉输注，成人推荐剂量为每日一次，每次 1g，在 30min 内输完。连续使用不超过 14 天，或肌肉注射（用盐酸利多卡因溶解）不超过 7 天。

肾功能不全病人应根据 CrCl 的测定结果调整剂量：CrCl 值每分钟 $>17.34\text{mL}/\text{m}^2$ ，每日一次，每次 1g；CrCl 值每分 $<7.34\text{mL}/\text{m}^2$ ，每日一次，每次 0.5g。

【药理作用】 本品是一种新型长效的 1- β -甲基碳青霉烯类抗生素，通过与青霉素结合蛋白（PBP）结合，抑制细菌细胞壁合成而发挥作用。

本品具有广谱抗菌活性，对包括革兰阳性、阴性需氧菌和厌氧菌均有活性，如无乳链球菌、肺炎双球菌、酿脓链球菌、大肠杆菌、脆弱拟杆菌和其他厌氧菌等。但对绿脓杆菌、不动杆菌、非典型性肺炎、万古霉素耐药或 MRSA 没有或仅有较弱的活性。

对多种 β -内酰胺酶稳定，而主要由金属- β -内酰胺酶水解；对革兰阳性菌存在抗生素后效应（PAE），而对阴性菌没有 PAE（除大肠杆菌）。

【药动学】 肌肉注射本品 1g 后几乎完全吸收，约 2.3h 后达血药峰值 $T_{\max}$ ，平均生物利用度约 90%。血浆蛋白结合率约为 85%~95%，稳态表观分布容积为 8.2L。健康成人的平均血浆半衰期 $t_{1/2}$ 约为 4h。

本品主要代谢产物为 β -内酰胺酶水解后的无活性开环衍生物（37%），38%为原型药物；血浆清除率约为 1.8L/h；本品主要经肾脏消除，随尿液排出（80%），一部分经粪便排出（10%）。

【临床评价】 治疗复杂的腹腔感染：研究对象包括革兰需氧菌阳性感染，革兰厌氧菌阳性感染，多种细菌合并感染，本品有效率为 93%。在一项对 195 例局限性并发的阑尾炎及并发的结肠、小肠和胆道感染及广泛性腹膜炎等其他腹内感染患者的临床试验中，每日一次静脉滴注本品 1g，连续 5~14 天，微生物学可评价人群中的综合临床和微生物学治愈率为 83.6%。

治疗复杂的皮肤和软组织感染：研究对象包括严重感染（占 22%）、合并需氧



菌和厌氧菌混合感染(39%)。对治疗多种细菌合并感染,本品临床有效率为80.3%,细菌学有效率81.8%。在一项对168例深部软组织脓肿、创伤后伤口感染和有脓液流出的蜂窝组织炎等患者的临床试验中,每日一次静脉滴注本品1g,连续7~14天,治愈率为83.9%。

治疗获得性肺炎:研究对象包括肺炎链球菌、莫拉菌和流感杆菌,给予本品,经至少3天静脉给药后,改为口服阿莫西林/克拉维酸治疗7~14天,本品的临床显效率和细菌学有效率分别为92.2%($n=182$)和91.5%($n=100$),耐受性较好。

治疗复杂的泌尿系统感染:经给予本品治疗,严重感染好转后,改口服环丙沙星治疗,细菌清除率为90.1%。

治疗急性盆腔炎:常见分离菌为大肠杆菌和厌氧菌,对163例产后感染和45例流产感染患者,每日一次静脉滴注本品1g,连续3~10天,本品的临床治愈率为93.9%。

【不良反应】 本品不良反应较轻,因药物不良反应终止治疗的占4.7%,总发生率为1%。主要包括:腹泻(5.5%)、头痛(2.2%)、女性阴道炎(2.1%)、静脉炎/血栓性静脉炎(1.3%)以及恶心呕吐(1.1%),并可能发生癫痫和其他中枢神经系统反应,出现不同程度的伪膜性肠炎。

试验室指标检查中,ALT升高占6%,AST升高占5.2%,血清碱性磷酸酶升高占3.4%,血小板计数升高占2.8%,嗜曙红细胞上升占1.1%。

【注意事项】 对本品任何成分过敏者、对同类药物或 β -内酰胺类过敏者、对酰胺类局麻药过敏者禁用。

本品可通过乳汁分泌,哺乳期妇女应慎用;18岁以下患者忌用。

注射液需用盐酸利多卡因溶解,不应与其他药物混合输注,不能用含葡萄糖溶液稀释。

接受透析治疗的病人,透析后应补充150mg(透析能清除30%的药物)。

另外本品使用前需溶解或稀释,推荐的溶剂为灭菌蒸馏水或0.9%氯化钠注射液。

【参考文献】

- [1] 曹国颖,傅得兴等.新型碳青霉烯类抗生素——艾他培南.中国临床药理学杂志,2005,21(1):74-78.
- [2] 郭文.碳青霉烯类抗生素ertapenem sodium.世界临床药物,2004,25(2):120-121.
- [3] Ann I Graul. The Year's New Drugs. Drug News Perspect, 2003, 16(1): Jan.-Feb.
- [4] Informatin Update: MK-0826. Drugs of the Future, 2001, 26(8): 811.
- [5] Teng C P, Chen H H, Chan J, Lye D C B. Ertapenem for the treatment of extended-spectrum β -lactamase-producing Gram-negative bacterial infections. International Journal of Antimicrobial Agents, 2007, 30(4): 356-359.

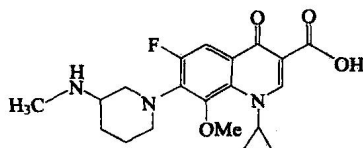
- [6] G3.2 Influence of ertapenem on cell activation and co-stimulatory molecule expressions. International Journal of Antimicrobial Agents, 2005, 26 (Suppl 1): S110.
- [7] Gill C J, et al. In vivo efficacy and pharmacokinetics. Antimicrob Ag Chemother, 1998, 42: 1996.
- [8] Kohler J, et al. In vitro efficacy and β -lactamase stability. Antimicrob Ag Chemother, 1999, 42: 1170.
- [9] http://www.fda.gov/medwatch/SAFETY/2005/Oct_PI/Invanz_PI.pdf.



巴洛沙星 Balofloxacin

【商品名】 Baloxin

【化学结构】



分子式: $C_{20}H_{24}FN_3O_4$ 相对分子质量: 389.42

【化学名称】

1-环丙基-6-氟-1,4-二氢-8-甲氧基-7-(3-甲氨基-1-哌啶基)-4-氧代-3-喹啉羧酸

1-cyclopropyl-6-fluoro-1,4-dihydro-8-methoxy-7-[3-(methylamino)-1-piperidinyl]-4-oxo-3-quinolinecarboxylic acid

【性状】 淡黄色或灰白色粉末, 无臭、味苦, 水溶液 pH 7.27, mp 134~135℃.

【CA 登录号】 [127294-70-6]

【化学文摘号】 CA 139: 46269

【专利号】 EP 342675, US 5051509

【知识产权状况】 专利优先权日: JP 880519.

【首创厂商】 日本 Daiichi Sankyo 会社, 韩国 Choongwae 公司.

【首次上市国家及时间】 2002 年 9 月首次在韩国上市.

【适应证】 新一代氟喹诺酮类抗菌药, 治疗由敏感革兰阴性菌、革兰阳性菌和厌氧菌引起的呼吸系统、泌尿系统、消化系统、皮肤软组织感染, 以及口腔科、耳鼻喉科、眼科、皮肤科等感染和淋球菌、沙眼衣原体所致的尿道炎、宫颈炎等.

【剂型规格】 片剂: 规格 100mg.

【用法用量】 口服, 每次 100~200mg, 每日一次或两次, 饭后服用, 连续 5~14 天.

【药理作用】 本品是广谱氟喹诺酮类抗菌剂, 主要通过抑制敏感菌 DNA 拓扑异构酶 II 和 IV 的活性使敏感菌 DNA 无法形成超螺旋, 进一步造成染色体的不可逆损害, 从而导致敏感菌无法分裂增殖直至死亡.