
大扶康 

(氟康唑)

文献摘要

DIFLUCAN

(fluconazole)

氟康唑

世界文献摘要

第Ⅱ卷

江苏工业学院图书馆

辉瑞制药有限公司教育拨款主办

藏书章

Adis 国际公司编辑

Adis 国际公司

Suite B-30, Oxford Court Bussiness Center
582 Middletown Boulevard
Langhorne, PA 19047 USA
Adis 国际公司 1991 年版权

目录

1. 药物动力学 1

氟康唑在人体内的药物动力学和组织穿透性。Brammer KW, Farrow PR 和 Faulkner JK. Rev Infect Dis 1990; 12(Suppl 3): S318-S326. 1

人的痰中氟康唑的水平。Ebden P, Neill L 和 Farrow PR. Antimicrob Agents Chemother 1989; 33(6):963-964. 3

氟康唑穿入阴道组织和分泌物。Dellenbach P. 医学服务皇家学会国际会议和专题讨论会系列号 160. 见: Richardson RG 编. 氟康唑及其在阴道念珠菌病中的作用. 医学服务皇家学会有限公司, 1989. 4

病人口服 1 剂氟康唑 150mg 后血浆和阴道分泌物中氟康唑水平以及阴道念珠菌感染的根除率。Houang ET, Chappatte O, Byrne D, Macrae PV 和 Thorpe JE. Antimicrob Agents Chemother 1990; 34(5): 909-910. 5

白色念珠菌脓毒性关节炎治疗成功时关节液中氟康唑的浓度。O'Meehan T, Varcoe R, Thomas M 和 Ellis-Pegler R. J Antimicrob Chemother 1990; 26:601-602. 6

肾功能障碍和血液透析对氟康唑药物动力学影响的评定。Toon S, Ross CE, Gokal R 和 Rowland M. Br J Clin Pharmacol 1990; 29(2):221-226. 7

接受连续不卧床性腹膜透析的病人中氟康唑的药物动力

学。Debruyne D, Ryckelynck J-P, Moulin M, Hurault de Ligny B, Levaltier B 和 Bigot M-C. Clin Pharmacokinet 1990; 18(6):491-498. 9

II · 药物相互作用。 10

氟康唑和利福平之间的相互作用。Coker RJ, Tomlinson DR, Parkin J, Harris JRW 和 Pinching AJ. Br Med J 1990; 301:818. 10

氟康唑 / 环孢菌素间没有显著的相互作用。Graves NM, Matas AS, Hilligoss DM 和 Canafax DM. Clin Pharmacol Ther 1990; 47(2):208. 11

氟康唑和环孢菌素间没有显著的相互作用。Krueger HU, Schuler U, Zimmermann R 和 Ehninger G. J Antimicrob Chemother. 1989; 24(5):781-786. 12

氟康唑和环孢菌素的相互作用。Sugar AM, Saunders C, Idelson BA 和 Bernard DB. Ann Intern Med 1989; 110(10):844. 13

口服抗酸剂对口服氟康唑的药物动力学的影响。Thorpe JE, Baker N 和 Bromet-Petit M. Antimicrob Agents Chemother 1990; 34(10):2032-2033. 15

在心脏和肺移植受者中环孢菌素和埃他康唑的相互作用。Kramer MR, Marshall SE, Denning DW 等。Ann Intern Med 1990; 113:327-329. 16

III · 药效学 17

氟康唑和氟胞嘧啶联合治疗鼠隐球菌性脑膜炎。
Allendoerfer R, Marquis AJ, Rinaldi MG 和 Graybill JR. 第十三届抗微生物制剂和化学治疗学科间会议论文摘要, 1990 年 10 月, 亚特兰大。文摘 1160 17

家兔实验性念珠菌性角膜炎的氟康唑局部治疗。
Behrens-Baumann W, Klinge B 和 Ruchel R. Br J Ophthalmol 1990; 74:40-42。 18

两性霉素 B、氟康唑和埃他康唑对巨噬细胞中细胞内白色念珠菌和发芽管发育的影响。Van't Wout JW, Meynaar I, Linde I, Poell R, Mattie H 和 Van Furth R. J Antimicrob Chemother 1990; 25:803-811。 19

氟康唑和人吞噬细胞间的相互作用。吞噬细胞对抗真菌药的摄取及对吞食的真菌活存的影响。Wildfeuer A, Laufen H 和 Haferkamp O. Arzneimittel-Forschung 1990; 40(II):1044-1047。 21

微生物对三唑类药的敏感性试验: 这是否正确?
Kobayashi GS 和 Spitzer ED. Eur J Clin Microbiol Infect Dis 1989; 8(5):387-389。 22

在口服避孕药和未服避孕药的健康妇女中小剂量氟康唑的代谢效应。Devenport MH, Crook D, Wynn V 和 Lees LJ. Br J Clin Pharmacol 1989; 27(6):851-859 24

IV · 临床试验

口咽部、食管和口腔念珠菌病 26

艾滋病病人口咽部念珠菌病的口服大剂量氟康唑治疗。
Ansari AM, Gould IM 和 Douglas JG. *J Antimicrob Ther* 1990; 25:720-721. 26

氟康唑和酮康唑治疗艾滋病中口咽部念珠菌病的比较。De Wit S, Goosens H, Weerts D 和 Clumeck N. *Lancet* 1989; 1(8641):746-747. 27

在患恶性肿瘤成年病人中氟康唑和克霉唑治疗口咽部念珠菌病的比较。McCloskey R, Hathorn J 和 Buell DN. 第十三届抗微生物制剂和化学治疗会议论文摘要, 1990 年 10 月, 亚特兰大, 墙报摘要 1280. 29

免疫损害病人中口咽部念珠菌病的治疗: 比较氟康唑和酮康唑的随机双盲研究。Meunier F, Aoun M 和 Gerard M. *Rev Infect Dis* 1990; 12:S364-S388. 31

氟康唑治疗 HIV-1 感染病人中的抗酮康唑口咽部念珠菌病。Thorsen S 和 Mathiesen LR. *Scand J Infect Dis* 1990; 22:375-376. 33

氟康唑治疗局部侵入性念珠菌病的随机比较研究。Johnson E, Marton R, Lake-Lewin D, Vincent D, Slim J 和 Kunzweiler J. 第十三届抗微生物制剂和化学治疗会议论文摘要, 1990 年 10 月, 亚特兰大. 摘要 1278. 34

免疫损害病人中的食管念珠菌病。Laine L. 在第十三届抗微生物制剂和化学治疗的学科间会议期间召开的一次专题讨论

会“机会性真菌感染的治疗进展”的论文摘要,1990年10月,亚特兰大。 36

在患恶性肿瘤成年病人中用氟康唑和两性霉素 B 治疗食管念珠菌病的比较。Lake-Lewin D, Kunzweiler J 和 Buell DN. 第十三届抗微生物制剂和化学治疗会议论文摘要,1990年10月,亚特兰大。墙报摘要 1279。 37

在艾滋病中用氟康唑和克霉唑锭剂治疗口腔鹅口疮的比较研究。Pons VG, Greenspan D, Koletar SL, Debruin MF, 和多中心研究组。第十三届抗微生物制剂和化学治疗会议论文摘要,1990年10月,亚特兰大。墙报摘要 1270。 39

人免疫缺陷病毒感染的病人中用口服氟康唑和克霉唑锭剂治疗口腔念珠菌病的比较。Koletar SL, Russell JA, Fass RJ 和 Plouffee JF. Antimicrob Agents Chemother 1990; 34(11):2267-2268。 41

氟康唑治疗与念珠菌有关的托牙性口炎。Budtz-Jorgensen E, Holmstrup P 和 Krogh P. Antimicrob Agents Chemother 1988; 30(12):1859-1863 42

阴道念珠菌病 44

口服 1 剂氟康唑与阴道内使用克霉唑 3 天治疗阴道念珠菌病的比较:一项国际多中心试验的报告。Andersen GM, Barrat J, Bergnan T, Brammer KW, Cohen J 和 Dellenbach P. Br J Obstet Gynecol 1989; 96:226-232。 44

氟康唑治疗阴道念珠菌病。Herzog RE 和 Ansmann EB.

Mycoses 1989; 32(4):204-208。	46
------------------------------------	----

氟康唑和酮康唑口服治疗阴道念珠菌病的比较:一项双盲多中心试验的报告。Kutzer E, Oittner R, Leodolter S 和 Brammer KW, Eur J Obstet Gynecol Reprod Biol 1988; 29:305-313。	47
---	----

对普通医疗中用 1 剂氟康唑 150mg 治疗阴道念珠菌病的效果和安全性的一项公开多中心研究。Phillips RJM, Watson SA 和 McKay FF. Br J Clin Pract 1990; 44(6):219-222。 ..	48
--	----

其他表面真菌感染 49

每周口服 1 次氟康唑 150mg 治疗体癣 / 股癣。Suchil Centro P, Montero-Gei F, Robles M, Perera-Ramirez A, Welsh O 和 Male O. Drug Investigation(印刷中)。	49
--	----

每周口服 1 次氟康唑 150mg 治疗脚癣。del Aguila R, Montero-Gei F, Robles M, perera-Ramirez A 和 Male O. Drug Investigation(印刷中)。	51
---	----

皮肤和淋巴管炎性孢子丝菌病的氟康唑治疗。Montero-Gei F, Stevens DA, Siles L 和 Melendez M.第十三届抗微生物制剂和化学治疗会议论文摘要,1990 年 10 月,亚特兰大。摘要 575。	53
--	----

氟康唑和眼的真菌感染。Cruciani M, Di Perri G, Concia E, Bassetti D, Bonora A, Mecca E, Panozzo G 和 Tomazzoli L. J Antimicrob Chemother 1990; 25:718-720。	54
---	----

球孢子菌病 55

球孢子菌病的氟康唑治疗。Galgiani JN, Catanzaro A, Graybill JR, Levine B, Larsen RA, Dismukes WE, Cloud GA 和 NIAID 真菌病研究组。第十三届抗微生物制剂和化学治疗会议论文摘要,1990 年 10 月,亚特兰大。摘要 574。 55

氟康唑治疗球孢子菌性脑膜炎。Tucker RM, Galgiani JN, Hanson LH 等。Rev Infect Dts 1990; 12(Suppl 3):S380-S388。 57

隐球菌病

氟康唑治疗隐球菌性脑膜炎的效果。Jones PD, Marriott D 和 Speed BR. Diagn Microbiol Infect Dis 1989; 12:235S-238S。 58

氟康唑或两性霉素 B:给急性隐球菌性脑膜炎病人选择适当的治疗。Powderly WG。国际传染病会议论文摘要,1990 年 7 月,蒙特利尔。 60

隐球菌性脑膜炎用两性霉素 B 和氟胞嘧啶治疗失败后氟康唑治疗成功。Beents SB 和 Powell G. DICP 1990; 24:883。 61

氟康唑治疗艾滋病病人的隐球菌病。Am J Med 1989; 87:353。 63

在全身性真菌感染病人中的其他试验 64

在中性白细胞减少的白血病患者中比较氟康唑(flu)和静脉注射两性霉素 B(IV-AMB)抗真菌预防效果的随机试验。Anaissie E, Reuben A, Cunningham K 和 Bodey G P. 第十三

届抗微生物制剂和化学治疗会议论文摘要,1990年10日,亚特兰大。摘要 572。…………… 64

氟康唑预防骨髓移植病人的真菌感染:一项以安慰剂作对照的双盲随机多中心试验的结果。Goodman J, Buell D, Gilbert G 和骨髓移植研究组。第十一届国际人和动物真菌学学会会议论文摘要,1991年6月,蒙特利尔。摘要 PS3.114。…………… 65

氟康唑预防口咽部念珠菌病。Samonis G, Rolston K, Karl C, Miller P 和 Bodey GP. Rev Infect Dis 1990; 12:S369-S373. 66

在艾滋病和艾滋病相关综合征病人中用每周一次氟康唑预防口咽部念珠菌病复发:一项用安慰剂作对照的双盲研究。Leen CLS, Dunbar EM, Ellis ME 和 Mandal BK. J Infect 1990; 21:55-60。…………… 68

氟康唑预防性治疗艾滋病中的念珠菌性食管炎。Lavilla P, Gil A, Valencia ME, Pintado V, Dupla JML 和 Puig JG.第六届国际艾滋病会议论文摘要,1990年6月,旧金山。摘要 466。69

氟康唑和两性霉素 B 用作预防与艾滋病有关的隐球菌性脑膜炎复发的维持治疗的比较。Powderly W, Saag M, Cloud G, Dismukes W, Meyer R, Robinson P, NIAID 艾滋病临床试验组,NIAID 真菌病研究组和辉瑞研究中心。第十三届抗微生物制剂和化学治疗会议论文摘要,1990年10月,亚特兰大。摘要 1162。…………… 70

艾滋病中隐球菌性脑膜炎经治疗后用氟康唑维持治疗的安慰剂对照试验 Bozzette SA, Larsen RA, Chiu J 等和加利福尼亚合作治疗组。N Engl J Med 1992; 324:580-584。…………… 72

真菌病的预防 74

器官移植受者用氟康唑成功地治疗侵入性真菌感染。Conti DJ, Tolkoﬀ-Rubin NE, Baker GP Jr 等。Transplantation 1989; 48(4):692-695。.....

用氟康唑治疗全身性真菌感染。Bernard E, Carles M. Toussaint-Gare M, Fournier JP 和 Dellamonica P. Path Biol 1989; 37:690-693。..... 75

链格孢长期感染用氟康唑治疗的效果。Diaz m, Puente R 和 Trevino MA. Lancet 1990;336:513。..... 76

氟康唑治疗急性白血病并发的肺毛霉菌病。Funada H, Miyake Y, Kanamori K, Okafuji K, Machi T 和 Matsuda T. Jpn J Med 1989; 28(2):228-231。..... 77

氟康唑治疗深部真菌病的临床研究 Ikemoto H. Diagn Microbiol Infect Dis 1989; 12:239S-247S。..... 79

正在进行临床研究的新的抗微生物制剂。外科的继发性真菌病:用氟康唑治疗。Kujath P 和 Lerch K. Infection 1989; 17(2):111-117。..... 81

用氟康唑对烟曲霉性肺炎作短期祛病治疗。Quist P 和 Tauris P. Scand J Infect Dis 1990; 22:749-750。..... 82

在不能用常规抗真菌制剂治疗的病人中用氟康唑治疗有生命危险的真菌感染。Robinson PA, Knirsch AK 和 Joseph JA. Rev Infect Dis 1990; 12(Suppl 3):S349-S363。..... 83

氟康唑治疗真菌病。Thomas MG 和 Ellis-Pegler RB. NZ Med J 1990; March 14:180. 84

氟康唑治疗全身性酵母感染。Cohen J. J Antimicrob Chemother 1989; 23:294-295. 85

氟康唑控制抗两性霉素的侵入性肝脾念珠菌病。Jakab K, Kelemen E, Prinz G 和 Torok I. Lancet 1990; 335(8687):473-474. 86

用 1 剂氟康唑治疗白色念珠菌性龟头包皮龟头炎。Kinghorn GR 和 Wooley PD. Int J STD AIDS 1990; 1:366-370. ... 87

氟康唑和念珠菌病。Kirk AJB, Gould FK, Freeman R, Corris PA 和 Dark JH. Lancet 1989; February 11:1989. ... 88

连续不卧床性腹膜透析并发的真菌性腹膜炎:用一种新的口服有效抗真菌药氟康唑治疗成功。Levine J, Bernard DB, Idelson BA, Farnham H, Saunders G 和 Sugar AM. Am J Med 1989; 86:825-827. 89

念珠菌性心内膜炎和用氟康唑及粒细胞-巨噬细胞集落刺激因子治疗。Martino P, Meloni G 和 Cassone A. Ann Intern Med 1990; 112(12):966-967. 90

氟康唑治疗光滑念珠菌(*Candida glabrata*)性腹膜炎。Thomas MG 和 Ellis-Pegler RB. J Antimicrob Chemother 1989; 24:94-96. 92

1 名体重不足的婴儿的氟康唑治疗。Viscoli C, Castagnola E, Corsini M, Gastaldi R, Soliani M 和 Terragna A. Eur J Clin Microbiol Infect Dis 1989; 8(10):925。 93

氟康唑治疗免疫损害儿童的念珠菌病。Viscoli C, Castagnola E, Fioredda F, Ciravegna B, Barigione G 和 Terragna A. Antimicrob Agents Chemother 1991; 35(2):365-367。 94

氟康唑在人体内的药物动力学和组织穿透性

-
- 作者** Brammer KW, Farrow PR 和 Faulkner JK
- 国家** 英国
- 出版物** Reviews of Infectious Diseases 12(Suppl 3):S318-S326, 1990
- 方法学** 本文综述氟康唑的药物动力学性质。氟康唑不论何种给药途径或剂型,其药物动力学都相似。健康人接受 1 剂口服或静脉注射,或每天 1 剂多次给药,氟康唑的生物利用度都超过 90%。药物动力学表明呈线性剂量依赖性。氟康唑的半衰期为 30h,在每天给药一次后,5 至 7 天内达到稳态浓度。在尿中排出的量几乎为 1 剂的 90%,80%为母体化合物。
- 氟康唑的所有剂型,包括100mg和200mg口服胶囊,口服糖浆,以盐水为基础的静脉输注液,均产生相似的血浆峰浓度。对肾功能障碍的患者的研究表明,氟康唑的分布容积没有显著不同。但血液透析使血浆浓度降低 48%。老年病人的药物动力学参数与年轻人中的相似。氟康唑容易穿入身体组织,穿透比率可作为药物在个别感染部位利用度的指标。氟康唑明显穿入患活动性球孢子菌性脑膜炎病人的脑脊液,达到治疗有效浓度。也见到穿入唾液、痰、皮肤和水疱液、以及阴道组织达高的水平。
- 结论** 氟康唑与酮康唑或埃他康唑相比,分子量较低,更易溶于水,生物利用度也较高。氟康唑由于吸收快

,口服生物利用度高,分布容积大,以及可达到较高的血浆浓度,被推荐用于治疗表面和全身性感染。

人的痰中氟康唑水平

作者	Ebden P, Neill L 和 Farrow PR
国家	英国
出版物	Antimicrobial Agent and Chemotherapy 33(6):963-964, 1989
方法学	11名有稳定性脓性支气管扩张的成年病人参加了本研究,从痰中浓度确定氟康唑在肺感染部位的利用度。病人口服 1 丸 150mg 的胶囊。4h 和 24h 后收集痰和静脉血样。
结果	4h后,血浆和痰中氟康唑的平均浓度分别为 3.54mcg/ml 和 3.71mcg/ml. 24h 后,这些值分别降到 2.37mcg/ml 和 2.23mcg/ml. 未见临床上明显的副作用或实验室检查异常。痰标本被唾液稍污染对这些数据无显著影响。
结论	氟康唑的痰中浓度与血浆中所见的相似。因此,应评价氟康唑用于治疗肺的真菌感染。

氟康唑穿入阴道组织和分泌物

作者	Dellenbach P
国家	法国
出版物	医学服务皇家学会国际会议和专题讨论会系160。见:Richardson RG 编。氟康唑及其在阴道念珠菌病中的作用。医学服务皇家学会有限公司;1989。
方法学	记述了2项公开研究。在每项研究中,给25名病人口服1剂氟康唑150mg。在第1项研究中,给施行了阴道组织切除手术的妇科手术的病人口服后2至70h,测定氟康唑穿入阴道组织的量。在第2项研究中,对有阴道念珠菌病的病人在服药后2至72h,测定阴道分泌物中氟康唑的浓度。
结果	在第1项研究中,血浆和阴道组织中测得的氟康唑浓度相似,令人满意地在治疗白色念珠菌感染的范围内(估计的最低抑制浓度[MIC]为0.5–1.5 $\mu\text{g}/\text{ml}$)。在第2项研究中,在6h时,在阴道分泌物中氟康唑的浓度达到至少2 $\mu\text{g}/\text{ml}$,1至2天中,平均浓度在白色念珠菌的MIC的估计范围内。
结论	在服用1剂150mg氟康唑后,阴道组织和分泌物中可保持其治疗浓度达48h以上。