

环丙沙星在健康哺乳期妇女血清与乳汁中浓度比较

王淑君 (浙江省温州市第三人民医院, 温州 325000)

曲静伟 (浙江省宁波市临床药理研究所, 宁波 315020)

环丙沙星(ciprofloxacin, 环丙氟哌酸)为第三代喹诺酮类抗菌药物, 临床上用于各种敏感菌所致的感染^[1]。本文用紫外分光光度法对环丙沙星在健康初产妇的血清及乳汁中的药物分布进行研究, 现将结果报告如下。

资料与方法

选择 9 例初产妇, 产后 3~4 d, 年龄 24~30 a, 体重 53~57 kg, 自然分娩。试验前肝功能, 肾功能和血象检查均为正常。用乳酸环丙沙星注射液(广州侨光制药厂生产)400 mg (200 ml), 静脉滴注于

初产妇, 滴速控制在 2 h, 滴定后分别于即刻, 0.25、0.5、1.0、2.0、4.0 和 6.0 h 采血及乳汁各 4.0 ml, 取血清 1.0 ml 和乳汁 2.0 ml, 按郎岳明等报道方法^[2]测定。

结 果

结果测得血清及乳汁中环丙沙星浓度见表 1, 按二室模型拟合, 显示 $\lg C$ 与时间 t 呈较好的线性关系, α 相和 β 相的 r 分别为 0.9986 和 0.9729, $t_{1/2\beta}$ 为 3.3 h, 有关参数用剩余法计算, 结果见表 2。

表1 乳酸环丙沙星静滴后血清及乳汁中的浓度($n=9 \bar{x} \pm s \mu\text{g/ml}$)

	时 间 (h)						
	即 刻	0.25	0.5	1.0	2.0	4.0	6.0
血 清	5.7 ± 0.4	4.7 ± 0.4	3.5 ± 0.2	2.7 ± 0.2	2.3 ± 0.2	1.8 ± 0.6	1.0 ± 0.1
乳 汁	0.7 ± 0.3	—	4.9 ± 1.8	3.3 ± 0.4	2.8 ± 0.6	2.1 ± 0.2	1.1 ± 0.2
乳汁/血清	0.12	—	1.40	1.22	1.21	1.17	1.10

表2 9例患者静滴环丙沙星注射液(0.4g)后的药动学参数($\bar{x} \pm s$)

A	B	α	β	$t_{1/2\alpha}$	$t_{1/2\beta}$	K_{10}	K_{21}	K_{21}
($\mu\text{g/ml}$)	($\mu\text{g/ml}$)	(h^{-1})	(h^{-1})	(h)	(h)	(h^{-1})	(h^{-1})	(h^{-1})
5.73 ± 0.4	3.02 ± 0.15	10.13 ± 0.4	0.21 ± 0.15	0.07 ± 0.10	3.33 ± 0.15	0.58 ± 0.30	6.13 ± 0.20	3.63 ± 0.20

讨 论

1 文献报道^[1]环丙沙星的血清消除半衰期 $t_{1/2\beta}$ 为 $2.8 \sim 4.2 \text{ h}$, $t_{1/2\alpha}$ 为 $5 \sim 10 \text{ min}$ 。本实验显示 $t_{1/2\beta}$ 为 3.3 h , $t_{1/2\alpha}$ 为 4 min 与文献报道基本一致。说明在健康产妇中环丙沙星的药代动力学和健康人无殊。

2 氟喹诺酮类药物进行动物试验时发现能损害动物的软骨,造成负重关节损坏而影响动物的正常活动,因而在国内外所有本类药物的说明书中均写明:孕妇,哺乳期妇女及成熟期前的儿童不宜使用(固给药的安全性尚未确定)。本文通过对9例初产妇的血清和乳汁中环丙沙星浓度在不同时段的测定,结果表明用环丙沙星的初产妇,在注射后能很快地在

乳汁中出现,且乳汁药物浓度高达 $4.9 \mu\text{g/ml}$,乳汁中的药物浓度与血清药物浓度比值可高达 $1.40/1$,用药6h后,乳汁中的药物浓度与血清药物浓度之比仍达 $1.1/1$,因此,即使过了6h,乳汁中的药物浓度仍较高,为了不影响婴儿,在哺乳期不宜使用本品。

参 考 文 献

- 1 陈新谦.金有豫主编,新编药理学.第十二版,北京:人民卫生出版社,1992:103
- 2 陈岳明等,氟喹诺酮类药物的血清浓度测定及氟喹诺酮的临床药动学研究,浙江医学情报,1992,(1):19

收稿日期:1995-12-18