

剂量下，所得的血浆暴露水平低于成人。

不良反应

在临床试验中，1534 名儿童（年龄 6 个月至 16 岁）接受了口服和静脉左氧氟沙星治疗。年龄在 6 个月至 5 岁的儿童接受 10 mg/kg 每日 2 次的左氧氟沙星，年龄超过 5 岁的儿童接受 10 mg/kg 每日一次的左氧氟沙星（最大剂量为每日 500 mg），总疗程为 10 天。

在临床试验中一个亚组的儿童（1340 名接受左氧氟沙星治疗，893 名接受非氟喹诺酮类药物治疗）参与了一项前瞻性长期监测研究。以评估在第一次给予研究药物 60 天和 1 年后试验方案定义的肌肉骨骼疾病（关节炎、关节炎、肌腱病症、步态异常）的发生率。接受左氧氟沙星治疗的儿童肌肉骨骼疾病的发生率显著地高于非氟喹诺酮类药物治疗的儿童，如下表（表 7）所示。

表 7：几种临床试验中的肌肉骨骼病发生率			
	左氧氟沙星 N = 1340	非氟喹诺酮类* N = 893	p 值^b
随访期			
60 天	28 (2.1%)	8 (0.9%)	p = 0.038
1 年^c	46 (3.4%)	16 (1.8%)	p = 0.025

注：a. 非氟喹诺酮类：头孢曲松、阿莫西林/克拉维酸、克拉霉素。
b. 双侧 Fisher[†] s 精确性试验。
c. 对 1199 名左氧氟沙星治疗的儿童和 804 名非氟喹诺酮类药物治疗的儿童进行了为期 1 年的评价访视。然而，肌肉骨骼疾病的发病率，采用在指定期间内所有参与试验儿童的所有报告事件计算，不管他们是否完成为期 1 年的评价访视。

在两个治疗组中，关节痛都是最常发生的肌肉骨骼疾病。在两个组中，绝大多数肌肉骨骼疾病涉及多个承重关节。疾病在 8/46（17%）左氧氟沙星治疗的儿童中为中度，在 35/46（76%）左氧氟沙星治疗的儿童中为轻度。大多数接受了镇痛剂治疗。左氧氟沙星治疗组的中位缓解时间为 7 天，在非氟喹诺酮物治疗组中位缓解时间为 9 天（在两个组中，均有约 80% 的患者在 2 个月内缓解）。没有儿童出现严重或重大的疾病，所有骨骼肌肉疾病缓解未遗留后遗症。

呕吐和腹泻是最常报告的不良事件，在左氧氟沙星治疗组和非氟喹诺酮物治疗组中发生率相似。

除了在儿科患者临床试验中报告的事件，在成人患者中于临床试验或售后监测中报告的事件也可能发生于儿科患者中。

【老年用药】

老年患者在接受氟喹诺酮类药物，例如左氧氟沙星期间，严重不良反应（包括肌腱断裂）的风险增加。在接受糖皮质激素联合治疗的患者中，这个风险进一步增加。肌腱炎或肌腱断裂可累及踝部、手部、肩部或其他肌腱部位，并可在治疗期间或治疗后发生。曾报告了氟喹诺酮类药物治疗后几个月发生的病例。在老年患者，尤其是接受糖皮质激素治疗的患者中，必须慎用左氧氟沙星。必须将这些潜在的副作用告知患者，如果出现肌腱炎或肌腱断裂的任何症状，建议停止左氧氟沙星治疗，并与医疗保健人员取得联系。

在 III 期临床试验中，1,945 名接受左氧氟沙星治疗的患者（26%）年龄 ≥ 65 岁，1081 名（14%）年龄介于 65 至 74 岁之间，864 名（12%）年龄等于或大于 75 岁。这些患者和年龄较小患者的安全性和有效性无明显差异，但不能排除某些老年患者的敏感性可能会更高。

上市报告中，已有与左氧氟沙星有关的严重，甚至致命的肝毒性。主要的致命性肝毒性报告发生在 65 岁或更大年龄中，且大多没有过敏反应。如果患者有肝炎的症状或指征应立即停用左氧氟沙星。

老年患者可能对 QT 间期的药物相关性作用更敏感。因此同时使用左氧氟沙星和某些可以导致 QT 间期延长的药物（例如 IA 或 III 类抗心律失常药物）或存在尖端扭转型室速危险因素（如已知 QT 间期延长、顽固性低血钾）的患者使用左氧氟沙星时应谨慎。

如果考虑肌酐清除率的差异，那么青年受试者和老年受试者左氧氟沙星的药代动力学特征没有显著差别。但是由于左氧氟沙星大部分是从肾脏排泄的，因此肾功能损害的患者发生药物毒性反应的危险性较高。而老年患者肾功能减退的可能性较大，因此选择剂量时应特别谨慎，而且需要同时监测肾功能。

流行病学研究报告使用氟喹诺酮类药物后两个月内主动脉瘤和主动脉夹层的发生率增加，尤其是老年患者。（见【注意事项】）。

【药物相互作用】

1. 整合剂：抗酸剂、硫酸铝、金属阳离子、多种维生素制剂

左氧氟沙星口服制剂

虽然左氧氟沙星与二价阳离子的螯合作用弱于其他氟喹诺酮类抗菌药物，但同时使用左氧氟沙星口服制剂和抗酸剂如镁或铝剂以及硫酸铝、金属阳离子例如铁及含锌的多种维生素制剂仍可能影响左氧氟沙星的胃肠吸收，导致全身药物浓度显著低于预期值。含有抗酸剂如镁或铝以及硫酸铝、金属阳离子例如铁及含锌的多种维生素制剂或去羟胆苷的药物可以明显影响左氧氟沙星的胃肠吸收，导致全身药物浓度显著低于预期。这些药物应在至少服用左氧氟沙星前两小时或服药后两小时服用。

左氧氟沙星注射剂

尚关于静脉滴注喹诺酮类抗菌药物与口服抗酸剂、硫酸铝、多种维生素制剂、去羟肌苷或金属阳离子之间相互作用的数据，但是喹诺酮类抗菌药物不应与任何含有多价阳离子如镁的溶液通过同一静脉输液通道滴注。

2. 华法林

一项在健康志愿者中进行的临床实验显示左氧氟沙星对 R- 和 S- 华法林的血浆峰浓度、AUC 和其他代谢参数没有明显作用。同样也未观察到华法林对左氧氟沙星的吸收和代谢有明显作用。曾有上市后监测报告指出左氧氟沙星可以增强华法林的药效。同时应用华法林和左氧氟沙星可以延长凝血酶原时间，从而导出出血时间延长。同时应用左氧氟沙星和华法林时应密切监测凝血酶原时间、国际标准化比值（INR）或其他抗凝试验，并注意患者有无出血的表现。

3. 抗糖尿病药物

联合应用喹诺酮类抗菌药物和抗糖尿病药物的患者可能出现血糖紊乱如高血糖和低血糖。因此，同时应用这些药物时应密切监测血糖水平。

4. 非甾体类抗炎药物

同时使用非甾体类抗炎药物和包括左氧氟沙星在内的喹诺酮类抗菌药物可以增加发生 CNS 刺激和抽搐发作的危险。

5. 茶碱

在一项有 14 名健康志愿者参加的临床试验中未发现左氧氟沙星对茶碱的血浆浓度、AUC 及其他代谢参数有明显影响。同样也未观察到茶碱对左氧氟沙星的吸收和代谢有明显作用。但是，同时应用其他喹诺酮类抗菌药物和茶碱可导致患者茶碱的清除半衰期延长、血液浓度升高，从而增加茶碱相关不良反应的发生率。因此，与左氧氟沙星同时使用时，应密切监测茶碱水平并对药物剂量进行适当调整。无论茶碱的血液浓度是否升高均有可能出现不良反应如癫痫。

6. 环孢素

一项在健康志愿者中进行的临床实验显示左氧氟沙星对环孢素的血浆浓度、AUC 和其他代谢参数没有明显作用。但曾有报道与其他某些喹诺酮类抗菌药物同时使用时，患者的环孢素血药水平升高。与其他无伴随用药的试验相比，同时使用环孢素可以轻度降低左氧氟沙星的 C_{max} 和 k_e，而 T_{max} 和 t_{1/2} 稍有延长，但此差异并不具有临床意义。因此，同时使用时不需调整左氧氟沙星和环孢素的剂量。

7. 地高辛

一项在健康志愿者中进行的临床实验显示左氧氟沙星对地高辛的血浆峰浓度、AUC 和其他代谢参数没有明显作用。地高辛对左氧氟沙星的吸收和代谢动力学也没有显著影响。因此，同时使用时不需调整左氧氟沙星和地高辛的剂量。

8. 丙磺舒和西咪替丁

一项在健康志愿者中进行的临床实验显示丙磺舒或西咪替丁对左氧氟沙星的吸收速率和吸收程度没有明显作用。与左氧氟沙星单独用药时相比，与丙磺舒或西咪替丁联合用药时，左氧氟沙星的 AUC 和 t_{1/2} 分别升高 27% ～ 38% 和 30%，CL_F/F 和 CL_R 降低 21% ～ 35%。虽然这一差异具有统计学显著性，但与丙磺舒或西咪替丁联合用药时不需要调整左氧氟沙星的剂量。

9. 与实验室或诊断检查的相互作用

包括左氧氟沙星的氟喹诺酮，用市售试剂盒进行尿筛查阿片制剂可能会产生假阳性结果，有必要采用更特异的方法确定阿片阳性结果。

【药物过量】

左氧氟沙星的急性毒性很低。单次给予大剂量左氧氟沙星后，小鼠、大鼠、狗和猴可以出现下列临床体征：共济失调、上睑下垂、自发活动减少、呼吸困难、衰竭、震颤及惊厥。口服剂量超过 1500 mg/kg 及注射剂量超过 250 mg/kg 时可使啮齿类动物死亡率显著升高。

喹诺酮类药物过量时，可出现以下症状：恶心、呕吐、胃痛、灼灼热、腹泻、口渴、口腔炎、躁动、头晕、头痛、全身倦怠、麻木感、发冷、发热、锥体外系症状、兴奋、幻觉、抽搐、谵狂、小脑共济失调、颅内压升高（头痛、呕吐、视神经乳头水肿）、代谢性酸中毒、血糖增高、GOT/GPT/ALP 增高、白细胞减少、嗜酸性粒细胞增加、血小板减少、溶血性血尿、软骨/关节障碍、白内障、视力障碍、色觉异常及复视。

急性过量时应洗胃（仅在服用口服制剂时），观察并给予水电、电解质支持疗法。血液透析或腹膜透析不能有效清除左氧氟沙星。

急救措施及解毒药：

（1）输液（加保肝药物）：代谢性酸中毒给予碳酸氢钠注射液，尿酸化给予碳酸氢钠注射液，以增加本品由肾脏的排泄。
（2）强制利尿：给予呋喃苯胺酸注射液。
（3）对症疗法：抽搐时应反复给予安定静脉注射液。

【药理毒理】

1. 药理作用

1) 作用机制：左氧氟沙星是氧氟沙星（消旋体）的左旋体，为喹诺酮类抗菌药物。氧氟沙星的抗菌作用主要由左旋体产生。左氧氟沙星及其他氟喹诺酮类抗菌药物的作用机制为抑制细菌 DNA 复制、转录、修复和重组所需的拓扑异构酶Ⅳ和 DNA 旋转酶（为拓扑异构酶Ⅱ）。

2) 耐药性：氟喹诺酮类耐药性由 DNA 旋转酶或拓扑异构酶Ⅳ的特定区域，也称为喹诺酮耐药性决定区（ORDR）的突变，或者药物外排系统改变产生。

氟喹诺酮类抗菌药物，包括左氧氟沙星，其化学结构和作用方式与氨基糖苷类、大环内酯类及 β-内酰胺类抗菌药物（包括青霉素）均不同。因此氟喹诺酮类药物对上述抗菌药物耐药的情况仍可能有效。

体外条件下由于自发变异而产生的对左氧氟沙星耐药的情况较少（范围：10⁹～10¹⁰）。虽然观察到左氧氟沙星和其他一些氟喹诺酮类药物之间存在交叉耐药，但对于其他氟喹诺酮类耐药菌的细菌仍有可能对左氧氟沙星敏感。

3) 体外和体内抗菌活性：

左氧氟沙星体外对多种革兰阴性 and 革兰阳性细菌均有抗菌作用。

在体外研究和临床感染中证明，左氧氟沙星对下列细菌的大多数分离株有抗菌作用：

***革兰阳性需氧菌：**粪肠球菌，金黄色葡萄球菌（甲氧西林敏感菌株），表皮葡萄球菌（甲氧西林敏感菌株），腐生葡萄球菌，肺炎链球菌（包括多重耐药性菌株 [MDRSP][†]），化脓性链球菌。

***MDRSP（多重耐药性肺炎链球菌）**指对下列两种或多种抗菌药物耐药的菌株：青霉素（MIC ≥ 2μg/ml）、二代头孢菌素如头孢呋辛、大环内酯类、四环素及甲氧苄氧嘧啶/磺胺甲噁唑。

革兰阴性需氧菌：阴沟肠杆菌，大肠埃希菌，流感嗜血杆菌，副流感嗜血杆菌，肺炎克雷伯菌，肺炎军团菌，卡他莫拉菌，奇异变形杆菌，铜绿假单胞菌*，粘质沙雷氏菌。

***** 与这类中的其他药物相同，使用左氧氟沙星进行治疗时，铜绿假单胞菌的某些菌株可很快产生耐药性。

其他微生物：肺炎衣原体，肺炎支原体。

下列数据为体外试验结果，但其临床意义未知：

体外条件下左氧氟沙星对下列微生物的大多数菌株（≥ 90%）的最小抑菌浓度（MIC 值）为 2μg/ml 或更低；但是左氧氟沙星治疗由这些微生物所引起的临床感染的安全性和有效性尚未在充分且有良好对照的临床试验中确定。

革兰阳性需氧菌：溶血性葡萄球菌，β-溶血链球菌（C/F 组），β-溶血链球菌（G 组），无乳链球菌，米勒链球菌，草绿色链球菌。

革兰阴性需氧菌：鲍曼不动杆菌，鲁氏不动杆菌，百日咳杆菌，柯林氏梭酸杆菌，弗氏柠檬酸杆菌，产气肠杆菌，坂崎氏肠杆菌，产酸克雷伯菌，摩根氏杆菌，聚团肠杆菌，普通变形杆菌，雷氏普罗威登斯菌，斯氏普罗威登斯菌，萤光假单胞杆菌，鼠疫杆菌。

***革兰阳性厌氧菌：**产气荚膜梭状芽胞杆菌。

4) 药效试验方法

适用时，临床微生物学实验室应提供当地医院和诊所所用抗菌药物体外药敏试验结果的定期累积报告，其中应描述医院和社区获得性病原体的药敏概况。这些报告有助于医生选择用于治疗的抗菌药物。

稀释法

通常采用定量方法测定抗菌药物的 MIC 值。MIC 值可用于估计细菌对于抗菌药物的敏感性。应采用标准化试验方法测定 MIC 值。标准试验方法基于美国临床实验室标准化协会（Clinical and Laboratory Standards Institute,CLSI）推荐的稀释法（肉汤或琼脂）或等同于标准接种浓度及标准左氧氟沙星粉末浓度 MIC 值应该根据表 8 中的标准进行判读。

折算法

也可采用测量抑菌圈直径的定量法重复估算细菌对抗菌药物的敏感性。通过抑菌圈直径可估算细菌对抗菌药物的敏感性。采用标准化方法测定抑菌圈直径。此方法使用含有 5μg 的纸片测定细菌对左氧氟沙星的敏感性。纸片法判读标准见表 8。

病原菌	最小抑菌浓度（mcg/L）			纸片扩散抑菌圈直径（mm）		
	敏感（S）	中介（I）	耐药（R）	敏感（S）	中介（I）	耐药（R）
肠杆菌	≤2	4	≥8	≥17	14–16	≤13
粪肠球菌	≤2	4	≥8	≥17	14–16	≤13
葡萄球菌属	≤2	4	≥8	≥17	14–16	≤13
铜绿假单胞菌	≤2	4	≥8	≥17	14–16	≤13
流感嗜血杆菌	≤2	-	-	≥17	-	-
副流感嗜血杆菌	≤2	-	-	≥17	-	-
肺炎链球菌	≤2	4	≥8	≥17	14–16	≤13
化脓性链球菌	≤2	4	≥8	≥17	14–16	≤13
鼠疫杆菌	≤0.25	-	-	-	-	-
炭疽杆菌	≤0.25	-	-	-	-	-

药效报告为“敏感”表示，抗菌药物在感染部位达到通常可达到的浓度时很可能能够抑制病原体生长。报告为“中介”（I）则提示结果可疑，如果微生物对替代药物、临床可得药物不够敏感，那么应该重复检测。此分类意味着在药物生理性汇集的身体部位或在以高剂量使用药物的情况下，此类药物具有临床适用性。此分类也提供了一个缓冲区，以因细菌小的未能控制的技术因素导致判读时出现大的偏差。报告为“耐药”（R）表示抗菌药物即使达到通常可在感染部位达到的浓度，也可能无法抑制病原体生长，应选择其他疗法。

质量控制

标准化药效试验方法需采用实验室对照品，以便监测和确保药物敏试验中所用样品和试剂以及试验操作人员技术的准确性和精确度。应提供具有表 9 中 MIC 值的左氧氟沙星粉末标准品。对于使用折算法的 5μg 的左氧氟沙星纸片的抑菌直径标准应该符合表 9 的数值。

质量控制菌株	最小抑菌浓度（mcg/L）	抑菌圈直径（mm）
粪肠球菌 ATCC 29212	0.25-2	-
大肠埃希菌 ATCC 25922	0.008-0.06	29-37
大肠埃希菌 ATCC 35218	0.015-0.06	-
流感嗜血杆菌 ATCC 49247	0.008-0.03	32-40
铜绿假单胞菌 ATCC 27853	0.5-4	19-26
金黄色葡萄球菌 ATCC 29213	0.06-0.5	-
金黄色葡萄球菌 ATCC 25923	-	25-30
肺炎链球菌 ATCC 49619	0.5-2	20-25

2. 毒理研究

遗传毒性

下列试验表明左氧氟沙星不具有致突变作用：Ames 细菌突变试验（鼠伤寒沙门菌和大肠埃希菌），CHO/HGPRT 正向突变试验，小鼠微核试验，小鼠显性致死试验，大鼠程序外 DNA 合成试验，小鼠姐妹染色单体互换试验。在体外染色体畸变（CHL 细胞系）和姐妹染色单体互换试验（CHL/IU 细胞系）中为阳性。

生殖毒性

大鼠经口剂量高达 360mg/kg/ 天时，左氧氟沙星对其繁殖能力没有损害，这一剂量相当于相对体表面积计算时人类最大推荐剂量的 4.2 倍。静脉滴注剂量为 100mg/kg/ 天 时，未见左氧氟沙星对其繁殖能力有损害，这一剂量相当于相对体表面积计算时人类最大推荐剂量的 1.2 倍。

大鼠经口给予左氧氟沙星剂量达 810mg/kg/ 天 时，相当于相对体表面积计算时人类最大推荐剂量的 9.4 倍，或静脉给予剂量最高达 160mg/kg/ 天，相当于相对体表面积计算时人类最大推荐剂量的 1.9 倍，未见致畸作用。大鼠经口给予左氧氟沙星剂量达 810mg/kg/ 天 时，可见胎前体重降低，胎仔死亡率增加。兔经口给予左氧氟沙星剂量达 50mg/kg/ 天 时，相当于相对体表面积计算时人类最大推荐剂量的 1.1 倍，或静脉给予剂量最高达 25mg/kg/ 天，相当于相对体表面积计算时人类最大推荐剂量的 0.5 倍，未见致畸作用。

致癌性

对大鼠生命全程的生物试验结果显示，每日拌食给予左氧氟沙星，连续服用 2 年，使用的最高剂量（100mg/kg/ 天）为根据相对体表面积计算人推荐最大剂量（750mg）的 1.4 倍，未见致癌性。任何剂量的左氧氟沙星均不能缩短 UV 诱发的白化裸鼠（Skh-1）皮肤肿瘤的进展时间，因此在本试验条件下不具有光致癌性。在光致癌性试验中，左氧氟沙星使用最大剂量（300mg/kg/ 天）时，裸鼠皮肤左氧氟沙星浓度范围在 25-42μg/g 之间。而在接受剂量为 750mg 左氧氟沙星的人类受试者中，其皮肤浓度的 C_{max} 平均约为 11.8μg/g。

幼龄动物毒性

左氧氟沙星和其他喹诺酮类抗菌药物已经表明可以导致大多数物种的幼龄试验动物发生关节病变。幼龄犬（4-5 月龄）经口给予左氧氟沙星，剂量为 10mg/kg/ 天，连续用药 7 天，或静脉给药，剂量为 4mg/kg/ 天，连续给药 14 天，均可引起关节损害。幼龄大鼠经口给予左氧氟沙星，剂量为 300mg/kg/ 天，连续用药 7 天，或静脉给药，剂量为 60mg/kg/ 天，连续给药 4 周，均可以引起关节病变。3 个月的幼龄猎犬，连续 14 天经口给予常规用量的左氧氟沙星 40mg/kg/day，在第 8 天出现严重的关节毒性而停药。在剂量≥ 2.5mg/kg 水平（根据比较血浆 AUC，约是儿童用量的 0.2 倍）时，可出现轻微肌肉骨骼损伤的临床表现，但尚无大体病理学和组织病理学损伤。剂量为 10 和 40mg/kg（分别为儿童用量的约 0.倍和 2.4 倍）时，可以引起滑膜炎和关节软骨损伤。恢复 18 周后，关节软骨大体病理学和组织病理学仍存在。

其它毒性

小鼠耳部肿胀试验显示左氧氟沙星的光毒性与氧氟沙星相似，但与其他喹诺酮类药物相比较弱。

虽然在某些静脉给药的大鼠试验中发现了结晶尿，但是结晶并不是在膀胱中形成的，而是在排尿后形成的，因此不意味着左氧氟沙星具有肾毒性。

与非甾体类抗炎药同时使用可以加重喹诺酮类药物对小鼠 CNS 的刺激作用。

左氧氟沙星的剂量为 6mg/kg 或更高时，快速静脉注射可以使犬产生低血压。这一作用可能与组胺的释放有关。

动物的体外和体内试验显示，在人体起治疗作用的血浆浓度范围内，左氧氟沙星既不是酶诱导剂，也不是酶抑制剂，因此，与其他药物或试剂不存在药物代谢酶相关的相互作用。

【药代动力学】

测定单次经口给予左氧氟沙星片剂、口服液或静脉注射给药后以及达稳态后左氧氟沙星的药代动力学参数，表示为 Mean±SD，总结于下表（表 10）。

治疗方案	C _{max} （μg/ml）	T _{max} （h）	AUC（μg·h/ml）	CL _F /F ¹ （ml/min）	Vd/F ² （L）	t _{1/2} （h）	CL _R （ml/min）
单次给药							
250 mg p.o. 片剂 ³	2.8 ± 0.4	1.6 ± 1.0	27.2 ± 3.9	156 ± 20	ND	7.3 ± 0.9	142 ± 21
500 mg p.o. 片剂 ^{3*}	5.1 ± 0.8	1.3 ± 0.6	47.9 ± 6.8	178 ± 28	ND	6.3 ± 0.6	103 ± 30
500 mg 口服液 ¹²	5.8 ± 1.8	0.8 ± 0.7	47.8 ± 10.8	183 ± 40	112 ± 37.2	7.0 ± 1.4	ND
500 mg i.v. ³	6.2 ± 1.0	1.0 ± 0.1	48.3 ± 5.4	175 ± 20	90 ± 11	6.4 ± 0.7	112 ± 25
750 mg p.o. 片剂 ^{5†}	9.3 ± 1.6	1.6 ± 0.8	101 ± 20	129 ± 24	83 ± 17	7.5 ± 0.9	ND
750 mg i.v. ⁵	11.5 ± 4.0 [†]	ND	110 ± 40	126 ± 39	75 ± 13	7.5 ± 1.6	ND
多次给药							
500 mg q24h p.o. 片剂 ²	5.7 ± 1.4	1.1 ± 0.4	47.5 ± 6.7	175 ± 25	102 ± 22	7.6 ± 1.6	116 ± 31
500 mg q24h i.v. ³	6.4 ± 0.8	ND	54.6 ± 11.1	158 ± 29	91 ± 12	7.0 ± 0.8	99 ± 28
500 mg 或 250 mg q24h i.v. 细菌感染患者 ⁶	8.7 ± 4.0 [†]	ND	72.5 ± 51.2 [†]	154 ± 72	111 ± 58	ND	ND
750 mg q24h p.o. 片剂 ²	8.6 ± 1.9	1.4 ± 0.5	90.7 ± 17.6	143 ± 29	100 ± 16	8.8 ± 1.5	116 ± 28
750 mg q24h i.v. ⁵	12.1 ± 4.1 [†]	ND	108 ± 34	126 ± 37	80 ± 27	7.9 ± 1.9	ND
500 mg p.o. 片剂，单次给药，性别和年龄因素：							
男性 ⁸	5.5 ± 1.1	1.2 ± 0.4	54.4 ± 18.9	166 ± 44	89 ± 13	7.5 ± 2.1	126 ± 38
女性 ⁸	7.0 ± 1.6	1.7 ± 0.5	67.7 ± 24.2	136 ± 44	62 ± 16	6.1 ± 0.8	106 ± 40
年轻人 ^{3b}	5.5 ± 1.0	1.5 ± 0.6	47.5 ± 9.8	182 ± 35	83 ± 18	6.0 ± 0.9	140 ± 33
老年人 ¹¹	7.0 ± 1.6	1.4 ± 0.5	74.7 ± 23.3	121 ± 33	67 ± 19	7.6 ± 2.0	91 ± 29
500 mg p.o. 单次给药，片剂，肾功能不全患者：							
CL _{CR} 50-80 ml/min	7.5 ± 1.8	1.5 ± 0.5	95.6 ± 11.8	88 ± 10	ND	9.1 ± 0.9	57 ± 8
CL _{CR} 20-49 ml/min	7.1 ± 3.1	2.1 ± 1.3	182.1 ± 62.6	51 ± 19	ND	27 ± 10	26 ± 13
CL _{CR} <20 ml/min	8.2 ± 2.6	1.1 ± 1.0	263.5 ± 72.5	33 ± 8	ND	35 ± 5	13 ± 3
血液透析	5.7 ± 1.0	2.8 ± 2.2	ND	ND	ND	76 ± 42	ND
CAPD	6.9 ± 2.3	1.4 ± 1.1	ND	ND	ND	51 ± 24	ND

注：① 清除率/生物利用度。