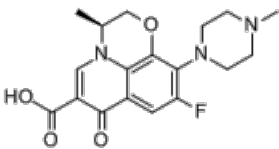




本PDF文件由 [www.ichemistry.cn](http://www.ichemistry.cn) 免费提供, 全部信息请点击[100986-85-4](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

如果您觉得本站对您的学习工作有帮助, 请与您的朋友一起分享:) [爱化学www.ichemistry.cn](http://www.ichemistry.cn)

#### CAS Number:100986-85-4 基本信息

中文名:	左氧氟沙星; 左旋氧氟沙星; 左氟沙星; 利复星
英文名:	Levofloxacin
别名:	LVFX; RWJ 25213; L-Ofloxacin; Ophthalmic; (-)-(S)-9-Fluoro-2,3-dihydro-3-methyl-10-(4-methyl-1-piperazin-yl)-7-oxo-7H-pyrido(1,2,3-de)-1,4-benzoxazine-6-carboxylic acid
分子结构:	
分子式:	C <sub>18</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>
分子量:	361.37
CAS登录号:	100986-85-4

#### 物理化学性质


熔点:	218°C
性质描述:	淡黄色结晶性粉末。

#### 安全信息

安全说明:	S26: 万一接触眼睛, 立即使用大量清水冲洗并送医诊治。 S36: 穿戴合适的防护服装。 S36/37/39: 穿戴合适的防护服、手套并使用防护眼镜或者面罩。
危险类别码:	R22: 吞咽有害。 R68: 可能有不可挽回的作用的危险 R20/21/22: 吸入、皮肤接触和不慎吞咽有害。 R42/43: 吸入和皮肤接触会导致过敏。

#### CAS#100986-85-4化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

将来试剂(上海)有限公司 专业从事100986-85-4及其他化工产品的生产销售 400-0066-400

 百灵威科技有限公司 左氧氟沙星专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 400-666-7788

供应商信息已更新且供应商的链接失效, 请登录爱化学 [CAS No. 100986-85-4](#) 查看

若您在此化学品供应商, 请按照[化工产品收录](#)说明进行免费添加

#### 其他信息

产品应用:	为全合成抗菌素, 治疗各种细菌感染。
-------	--------------------

**1. 左氧氟沙星(100986-85-4)的制备方法:**

左氧氟沙星的合成主要在于手性中心的引入,其制备方法大致可以分为以下几种:

**1. 方法一:**

由外消旋的氧氟沙星经填充特殊固定相的高效液相色谱柱直接拆分得左旋体;或将氧氟沙星以硫酸羟胺处理后,用盐酸酸化得盐酸盐经碱性离子交换柱处理,得到的两性化合物,加入(S)-(+)-扁桃酸,其与(-)-异构体成盐后形成结晶,可通过离子交换树脂,再经还原脱氨基得产品。

**2. 方法二:**

以2,3,4,5-四氟苯甲酸为原料,通过常用的方法制得2-(乙氧亚甲基)-3-氧代-3-(2,3,4,5-四氟苯基)丙酸乙酯后,再与(S)-2-氨基丙醇反应引入不对称碳原子,然后闭环、水解、引入甲基哌嗪而得产品。

**3. 方法三:**

也可以2,3-二氟-6-硝基苯酚为原料,与R构型的对甲苯磺酸缩水甘油酯在相转移催化剂存在下反应生成光学活性化合物,然后经还原并与乙氧亚甲基丙二酸二乙酯(EMME)缩合,再经Mitsunobu试剂处理,闭环,再闭环,水解,引入哌嗪基得产品。

**2. 左氧氟沙星(100986-85-4)的药理毒理:**

本品具有广谱抗菌作用,抗菌作用强,对多数肠杆菌科细菌,如大肠埃希菌、克雷伯菌属、变形杆菌属、沙门菌属、志贺菌属和流感嗜血杆菌、嗜肺军团菌、淋病奈瑟菌等革兰阴性菌有较强的抗菌活性。对金黄色葡萄球菌、肺炎链球菌、化脓性链球菌等革兰阳性菌和肺炎支原体、肺炎衣原体也有抗菌作用,但对厌氧菌和肠球菌的作用较差。本品为氧氟沙星的左旋体,其体外抗菌活性约为氧氟沙星的两倍。其作用机制是通过抑制细菌DNA旋转酶的活性,阻止细菌DNA的合成和复制而导致细菌死亡。

**3. 药代动力学:**

口服后吸收完全,相对生物利用度接近100%。单剂量空腹口服0.1g和0.2g后,血药峰浓度(C<sub>max</sub>)分别达1.36mg/L和3.06mg/L,达峰时间(T<sub>max</sub>)约为1小时。血消除半衰期(t<sub>1/2β</sub>)约为5.1~7.1小时。蛋白结合率约为30%~40%。本品吸收后广泛分布至各组织、体液,在扁桃体、前列腺组织、痰液、泪液、妇女生殖道组织、皮肤和唾液等组织和体液中的浓度与血药浓度之比约在1.1~2.1之间。本品主要以原形自肾排泄,在体内代谢甚少。口服48小时内尿中排出量约为给药量的80%~90%。本品以原形自粪便中排出少量,给药后72小时内累积排出量少于给药量的4%。

**4. 适应症:**

适用于敏感菌引起的:

1. 泌尿生殖系统感染,包括单纯性、复杂性尿路感染、细菌性前列腺炎、淋病奈瑟菌尿道炎或宫颈炎(包括产酶株所致者)。
2. 呼吸道感染,包括敏感革兰阴性杆菌所致支气管感染急性发作及肺部感染。
3. 胃肠道感染,由志贺菌属、沙门菌属、产肠毒素大肠杆菌、亲水气单胞菌、副溶血弧菌等所致。
4. 伤寒。
5. 骨和关节感染。
6. 皮肤软组织感染。
7. 败血症等全身感染。

**5. 用法用量:**

口服。成人常用量:

1. 支气管感染、肺部感染:一次0.2g,一日2次,或一次0.1g,一日3次,疗程7~14日。
2. 急性单纯性下尿路感染:一次0.1g,一日2次,疗程5~7日;复杂性尿路感染:一次0.2g,一日2次,或一次0.1g,一日3次,疗程10~14日。
3. 细菌性前列腺炎:一次0.2g,一日2次,疗程6周。

成人常用量为一日0.3~0.4g,分2~3次服用,如感染较重或感染病原体敏感性较差者,如铜绿假单胞菌等假单胞菌属细菌感染的治疗剂量也可增至一日0.6g,分3次服。

**6. 左氧氟沙星(100986-85-4)的不良反应:**

1. 胃肠道反应:腹部不适或疼痛、腹泻、恶心或呕吐。
2. 中枢神经系统反应可有头昏、头痛、嗜睡或失眠。
3. 过敏反应:皮疹、皮肤瘙痒,偶可发生渗出性多形性红斑及血管神经性水肿。光敏反应较少见。
4. 偶可发生:

生产方法及其他:

- (1) 癫痫发作、精神异常、烦躁不安、意识混乱、幻觉、震颤。
  - (2) 血尿、发热、皮疹等间质性肾炎表现。
  - (3) 静脉炎。
  - (4) 结晶尿，多见于高剂量应用时。
  - (5) 关节疼痛。
5. 少数患者可发生血清氨基转移酶升高、血尿素氮增高及周围血象白细胞降低，多属轻度，并呈一过性。

#### 7. 禁忌症：

对本品及氟喹诺酮类药物过敏的患者禁用。

#### 8. 左氧氟沙星(100986-85-4)的注意事项：

1. 由于目前大肠埃希菌对氟喹诺酮类药物耐药者多见，应在给药前留取尿培养标本，参考细菌药敏结果调整用药。
2. 本品大剂量应用或尿pH值在7以上时可发生结晶尿。为避免结晶尿的发生，宜多饮水，保持24小时排尿量在1200ml以上。
3. 肾功能减退者，需根据肾功能调整给药剂量。
4. 应用本品时应避免过度暴露于阳光，如发生光敏反应或其他过敏症状需停药。
5. 肝功能减退时，如属重度（肝硬化腹水）可减少药物清除，血药浓度增高，肝、肾功能均减退者尤为明显，均需权衡利弊后应用，并调整剂量。
6. 原有中枢神经系统疾病者，例如癫痫及癫痫病史者均应避免应用，有指征时需仔细权衡利弊后应用。
7. 偶有用药后发生跟腱炎或跟腱断裂的报告，如有上述症状发生，须立即停药，直至症状消失。

#### 9. 孕妇及哺乳期妇女用药：

动物实验未证实喹诺酮类药物有致畸作用，但对孕妇用药进行的研究尚无明确结论。鉴于本药可引起未成年动物关节病变，故孕妇禁用，哺乳期妇女应用本品时应暂停哺乳。

#### 10. 儿童用药：

本品在婴幼儿及18岁以下青少年的安全性尚未确定。但本品用于数种幼龄动物时，可致关节病变。因此不宜用于18岁以下的小儿及青少年。

#### 11. 老年患者用药：

老年患者常有肾功能减退，因本品部分经肾排出，需减量应用。

#### 12. 左氧氟沙星(100986-85-4)的药物相互作用：

1. 尿碱化剂可减低本品在尿中的溶解度，导致结晶尿和肾毒性。
2. 喹诺酮类抗菌药与茶碱类合用时可能由于与细胞色素P450结合部位的竞争性抑制，导致茶碱类的肝清除明显减少，血消除半衰期( $t_{1/2}$ )延长，血药浓度升高，出现茶碱中毒症状，如恶心、呕吐、震颤、不安、激动、抽搐、心悸等。本品对茶碱的代谢虽影响较小，但合用时仍应测定茶碱类血药浓度和调整剂量。
3. 本品与环孢素合用，可使环孢素的血药浓度升高，必须监测环孢素血浓度，并调整剂量。
4. 本品与抗凝药华法林合用时虽对后者的抗凝作用增强较小，但合用时也应严密监测患者的凝血酶原时间。
5. 丙磺舒可减少本品自肾小管分泌约50%，合用时可因本品血浓度增高而产生毒性。
6. 本品可干扰咖啡因的代谢，从而导致咖啡因消除减少，血消除半衰期( $t_{1/2\beta}$ )延长，并可能产生中枢神经系统毒性。
7. 含铝、镁的制酸药、铁剂均可减少本品的口服吸收，不宜合用。
8. 本品与非甾体类抗炎药芬布芬合用时，偶有抽搐发生，因此不宜与芬布芬合用。
9. 本品与口服降血糖药合用可能会引起血糖失调，因此用药过程中应注意监测血糖浓度，一旦发生低血糖时应立即停用本品，并给予适当处理。

#### 13. 参数：

- 1、疏水参数计算参考值(XlogP): -0.4
- 2、氢键供体数量: 1
- 3、氢键受体数量: 8
- 4、可旋转化学键数量: 2
- 5、常温常压下稳定，避免与强氧化剂接触。密封储存，储存于阴凉、干燥的库房。

相关化学品信息

[104830-21-9](#) [102056-97-3](#) [1078-39-3](#) [1076198-07-6](#) [102288-42-6](#) [102342-36-9](#) [102584-24-7](#) [2,6-二甲基吡啶](#) [二氢乙锭](#) [5-乙基吡啶-2,3-二羧酸](#) [104776-71-8](#) [108439-88-9](#) [101418-39-7](#) [108796-57-2](#) [100991-83-1](#) 454

生成时间2014-6-6 8:54:37