

高雄
榮總

藥訊

藥劑部出版

中華民國80年10月創刊

中華民國89年9月

本期要目：

- ▲新藥介紹—Fosfomycin granule
- ▲抗微生物劑講座(XXV)
- ▲醫藥文獻新知摘要選粹
- ▲每期專欄—維生素K依賴性蛋白質

問答錄問答錄問

藥物諮詢信箱

問答錄問答錄

**問：Metformin 用於婦產科多囊性
卵巢症候群的機轉為何？**

答：Metformin 原本是一口服抗高血糖用藥。1998年有研究指出Metformin可恢復肥胖婦女罹患多囊性卵巢症 (polycystic ovary syndrome, 簡稱PCOS)的正常月經及排卵功能。雖然美國FDA並未核准這種用法，但已有很多文獻發表確實效果良好。PCOS常造成月經不規則，無排卵或排卵稀少、多毛症及面皰形成。近年來，更多的資訊顯示PCOS與insulin的阻抗及高胰島素血症有關。過多的胰島素作用在卵巢造成卵巢腫大，增加androgen分泌及阻礙濾泡的發展。過去的治療包括給予口服避孕藥、Cyproterone、Clomiphene等。最近的焦點已發展為給予胰島素的激活劑如Metformin或troglitazone。Metformin的

劑量為500mg，每天3次，使用4-6個月。有95%的病人回復正常的月經，並有19%因而懷孕。有很多的實驗均假設高胰島素血會刺激卵巢中Cytochrome p450 C17- α 的活性，使testosterone的生成增加。而Metformin除了降低肝臟葡萄糖的生成及降低腸道葡萄糖的吸收以外，主要是它可增加insulin作用在receptor的敏感性，改進周邊葡萄糖的再利用。Metformin亦可與clomiphene併用，增加排卵的機率。

參考資料：

- ① Hopkinson et al: PCOS: the metabolic syndrome comes to gynaecology. Br Med J 1998;317:329-332.
- ② Nestler et al: Effects of metformin on spontaneous and clomiphene-induced ovulation in the PCOS. N Engl J Med 1998;338:1876-1880.(曾淑鈺總藥師)

抗微生物劑講座 (XXV)

感染科主任 劉永慶醫師

第四代 Quinolones

包括 levofloxacin, grepafloxacin, moxifloxacin 及 trovafloxacin 等，除了對革蘭氏陰性細菌仍有效外，對革蘭氏陽性細菌比第三代 quinolones 加強許多，為其一重要的特點；另一特點是對呼吸道病原菌像 *Pneumococcus*, *Staphylococci*, *Haemophilus influenzae*, *Moraxella catarrhalis*, *Legionella sp.*, *Mycoplasma sp.*, *Chlamydia sp.*, *Mycobacterium sp.* 及厭氧菌等皆有很好的效果，因此可用於下呼吸道感染之經驗性與第一線用藥。但由於 fluoroquinolones 有其特有的藥物不良反應，現已有三件在市面上撤出，其中兩件為第四代 quinolones，1998 年 trovafloxacin 引起肝功能異常及 1999 年 grepafloxacin 引起 torsade de points 與心律不整，另一件為 1992 年 temafloxacin 引起低血糖與溶血。

體外敏感性範圍

極敏感

Enterobacteriaceae	<i>Pneumococcus</i>
<i>H. influenzae</i>	<i>Staphylococci</i>
<i>M. catarrhalis</i>	(methicillin-sensitive)
<i>Legionella sp.</i>	<i>Gonococcus</i>

中度敏感

<i>Salmonella</i>	<i>Staphylococci</i>
<i>Shigella</i>	(methicillin-resistant)
<i>Mycoplasma sp.</i>	Anaerobes
<i>Chlamydia sp.</i>	(包括 <i>B. fragilis</i>)
<i>Mycobacterium sp.</i>	

輕度敏感

<i>P. aeruginosa</i>	<i>E. faecalis</i>
<i>Acinetobacter</i>	

無敏感

<i>Nocardia</i>	<i>E. faecium</i>
-----------------	-------------------

製劑

基本上所有的第四代 quinolones 皆有口服劑型與注射劑型，但在市面上只有 levofloxacin 有注射劑型。

劑量

Levofloxacin

成人：500mg q12h(PO&IV)

Moxifloxacin

成人：200mg q12h(PO)

Trovafloxacin

成人：200mg qd(PO&IV)

Grepafloxacin

成人：400mg(loading) and then
200mg qd(PO)

不良反應：

(1)基本上與其他的 fluoroquinolones 不良反應相同，只是程度上之差別，包括腸胃不適，中樞神經副作用及過敏反應等等。

(2)Trovafloxacin 已因肝功能異常，grepafloxacin 已因心律不整而由市面上消失。

說明：

(1)最重要的適應症為呼吸道感染，特別是下呼吸道感染症，由於有口服劑型，部份病患可在門診治療即可。

(2)另外由於對厭氧菌亦有效，所以可用於治療腹內感染症。

(3)由於對 *P. aeruginosa* 之感受性相對降低，所以不可用於治療 *P. aeruginosa* 所引起之感染症。

(4)不可用於懷孕婦女，哺乳婦女及成長之小孩。

(5)食物及制酸劑等胃藥會影響其吸收。

後記：本院常備藥有 levofloxacin 口服劑型。

新藥介紹一

Fosfomycin granule powder 3gm/package

曾碧萊總藥師

【藥理作用、抗菌範圍及適應症】

Fosfomycin 是 phosphonic acid 衍生物，為一個廣效性的殺菌劑。作用機轉為抑制 pyruvyl transferase，使 N-acetylglucosamine 無法轉換為 N-acetylmuramic acid，因此抑制細菌細胞壁 (peptidoglycan) 的合成。體外實驗顯示 fosfomycin 可對抗對多種革蘭氏陽性及陰性菌，包括：staphylococci 及 S. saprophiticus)、pneumococci、E.coli、Salmonella、Shigella、H.influenzae、Neisseria spp 及某些 Ps.aeruginosa、indole-negative Proteus、Providencia 菌珠。對於 Proteus mirabilis、Serratia spp、Enterobacter spp、Klebsiella spp 及 enterococci 則效果較弱。對於 B.fragilis 及厭氧的革蘭氏陽性球菌無效。FDA 核准用於非複雜性的泌尿道感染。

【藥物動力學】

Fosfomycin tromethamine 口服後生體可用率為 34-58%，不受食物的影響；達最高血中濃度時間為：2 小時。蛋白結合率極低 (<3%)，此藥不被代謝，主以原型由腎臟排除，<0.5% 由膽汁排出，排除半衰期為 5.7(4-8) 小時，因此腎功能障礙者 (Ccr < 10ml/min)，排除半衰期會延長至 50 小時。此藥服用後，尿液藥物濃度於前 4 小時可達 2000-3000mcg/ml，於用藥後 48 小時，尿液藥物濃度仍然 >100mcg/ml。

【副作用】

Fosfomycin 的耐受性良好，副作用多短暫而輕微，被報導的有胃腸道方面（腹瀉、噁心、嘔吐）、中樞神經方面（頭痛、疲倦、暈眩）、皮膚方面（皮疹）。研究顯示：此藥可安全用於懷孕婦女的菌尿

症。

【使用劑量】

1. 用於女性非複雜性的泌尿道感染：口服 3g 單一劑量。
2. 用於男性非複雜性的泌尿道感染或複雜性的泌尿道感染：每日口服 3g，使用 2-3 天。
3. 用於小兒非複雜性的泌尿道感染：口服 2g 單一劑量。（用於 1 歲以下的胎兒，使用 1g）
4. 腎功能障礙者 (Ccr < 10ml/min)，排除半衰期會延長至 50 小時，但目前尚未有建議的使用劑量。
5. 血液透析會有效移除 fosfomycin，建議於洗腎後給予新的劑量。

臨床研究(列舉本院現有的藥物之比較)：

1. 62 位排尿困難／頻繁的患者，分別使用 3g 單一劑量的 fosfomycin tromethamine 或 amoxicillin 250mg/clavulanic acid 125 mg q8h x 5d，結果顯示：兩者的效果相當，且副作用發生率亦相似。
2. 用於非複雜性的泌尿道感染：口服 3g 單一劑量 (fosfomycin tromethamine 的效果至少與 cotrimoxazole (sulfamethoxazole-trimethoprim) 960mg/d x 3d 相當。另用於女性非複雜性的泌尿道感染：口服單一劑量 3g fosfomycin tromethamine 或 cotrimoxazole 1.92g，兩者的效果相當，且副作用的發生率及嚴重度亦相似，唯 fosfomycin 組腹瀉比率較高。

【包裝】

Fosfomycin tromethamine granular powder 商品名 Monurol，每包 8g 中含有 fosfomycin tromethamine 5.631g (相當於 fosfomycin base 3g)。

引言:

維生素 K 屬於為脂溶性維生素，是在 1935 年由 Henrick Dam 因從事雞的實驗(給予雞餵食無脂肪的食物，呈現出血的症狀)而發現的。後經由純化發現維生素 K 在自然界以兩種型式存在：Phylloquinone (Vit K1) 存於植物中，是食物中維生素 K 的主要來源，Menaquinones (Vit K2) 則是經由細菌產生的，可於人類腸道的下半部合成。簡化起見，本篇以“維生素 K”一辭作代表。

起初 Henrick Dam 觀察到出血與凝血酵素 (thrombin-factor II) 活性的降低有關，後來顯示在維生素 K 缺乏的狀態下，凝血因子 VII, IX, X 亦會受壓抑。因此多年以來，均認為維生素 K 的生理活性只局限於合成上述 4 種凝血因子。但自 1974 年發現氨基酸 γ -carboxyglutamic acid (Gla)，更闡明了維生素 K 的生化功能及促使其他的維生素 K 依賴型蛋白質被發現。因此在肝臟中涉及血液凝聚且含有 Gla 的蛋白質如: protein C, protein S 及 protein Z，已被證實需依賴維生素 K 來維持其生理活性。最重要的是由於 Gla 而發現許多肝外的維生素 K 依賴型蛋白質。從腎臟、腎結石及動脈粥狀硬塊中可分離出含有 Gla 的蛋白質，另從骨骼中亦可分離出兩種含有 Gla 的蛋白質: 骨鈣蛋白質(osteocalcin - bone Gla protein) 及 matrix Gla protein。最近，又發現了存在於各種軟組織內的 gas6，它是一種含 Gla 的蛋白質，為生長停止專一基因 6 的產物。整體而言，這些肝外維生素 K 依賴型蛋白質的發現，顯示維生素 K 除了在血液凝固中扮演重要角色外，尚具有其他生理功能，值得我們去研究發展。

維生素 K 代謝方面的角色

還原型態的維生素 K

(hydroquinone) 在氧氣及二氧化碳的存在下，受內質網表面的脫羧酵素(carboxylase) 催化，會氧化成 vitamin K 2,3-epoxide，同時使得含 glutamic acid (Glu) 的蛋白質轉換成含 Gla 的蛋白質。而 Vitamin K 2,3-epoxide 能再經由 vitamin K epoxide 還原酶及 vitamin K quinone 還原酶催化還原成 quinone 及 hydroquinone 型態重新使用，此兩種 dithiol 依賴性還原酶會受 4-hydroxycoumarin 抗凝劑(如: warfarin) 的抑制，而呈現抗凝劑的藥理作用。另有一種 NAD(P)H 依賴性的 quinone 還原酶亦可還原 vitamin K 2,3-epoxide，且對 coumarin 抗凝劑不敏感，但需在抗凝劑中毒、組織中維生素 K 濃度過高時才會發揮作用。當維生素 K 缺乏或使用其拮抗劑 warfarin 時，前趨性蛋白質的脫羧化不完全，造成各種不完全脫羧化型態的蛋白質分泌於血漿中，這些蛋白質稱為: PIVKAs (protein induced by vitamin K absence or antagonism)，不具生化活性，但可用為體內維生素 K 不足的指標。

維生素 K 依賴性凝血蛋白

人體有 7 種維生素 K 依賴性的蛋白質牽涉到血液凝固: prothrombin (factor II), VII, IX 及 X、proteins C, S 及 Z；前 4 種具促凝血作用，proteins C, S 具抗凝血作用，而 proteins Z 的功能尚不清楚。這些蛋白質主於肝臟合成，分子量介於: 45000-72000 Da；但 proteins S 尚存於人類骨基質的蛋白抽取物中，且骨母細胞能合成並分泌 proteins S。

Gla 大分子結構中有 10-12 個殘基，在轉換成維生素 K 依賴性蛋白質時仍保留 9 個殘基，這些 Gla 殘基可增加蛋白質與鈣離子的結合，因此促使凝血蛋白與受傷部位的內皮細胞及血小板表面帶負電的磷脂結合，造成凝血。Gla 殘基的存在會影響凝血蛋白的功能，如：prothrombin 通常具有 10 個 Gla 殘基，當其 Gla 殘基減少至 9 個或 8 個時，其凝血的活性會由 100% 降至 78% 或 20%；如 Gla 殘基數目 ≤ 6 ，則凝血的活性不到 2%。

某些維生素 K 依賴性的蛋白質除靠 Gla 殘基外，具有另一種修正型態：

β -hydroxyaspartate 或

β -hydroxyasparagine，可促使其與鈣離子的結合。

凝血因子 II, VII, IX 及 X

此 4 種維生素 K 依賴性凝血因子均參與身體凝血的過程：凝血因子 VII, IX 分別經由外因性及內因性的凝血步驟活化凝血因子 X，受活化的凝血因子 X 可使凝血酵素轉變為凝血酶原(prothrombin -Factor II)，進一步促使纖維蛋白凝塊的形成。

Proteins C 及 S

Proteins C 及 S 與前述凝血因子相反，為促凝系統的抑制劑。Proteins C 為一雙鏈的醣蛋白(分子量: 62000 Da)，含有 11 個 Gla 殘基；當凝血酵素於鈣的存在下，與內皮細胞表面的接受體(thrombomodulin)結合時，可促使 Proteins C 的活化，進而將已活化的凝血因子 V 及 VIII 去活化，阻止血液凝集，同時 Proteins C 亦具有明顯的纖維蛋白溶解作用。

Proteins S 為一單鏈的醣蛋白(分子量: 69000 Da)，含有 10 個 Gla 殘基，於血漿中呈游離態及與抑制補體系統的蛋白質(C4b-binding protein)結合。Proteins S 在 Proteins C 將凝血因子 V 及 VIII 去活化及促使纖維蛋白溶解的作用中，扮演輔酶的

角色。

維生素 K 依賴性骨蛋白

於 1970 年代中期，Hauschka 等人報導骨中含有相當量的 Gla，自此又發現三種需依賴維生素 K 以維持其生理活性的骨蛋白：骨鈣蛋白質(osteocalcin - bone Gla protein)、matrix Gla protein 及 protein S。

骨鈣蛋白質(osteocalcin)

骨鈣蛋白質為一低分子量蛋白，含有 3 個 Gla 殘基，因此其與磷灰石的親和力遠，比其與鈣離子的親和力高；骨鈣蛋白質完全由骨母細胞及牙質母細胞所合成，是人體最豐富的非膠原骨蛋白。活性維生素 D [$1,25-(OH)_2D_3$] 能刺激骨鈣蛋白質的合成，動物研究顯示：血中的骨鈣蛋白質乃經由新細胞的合成，然後釋出至血液中，並非經蝕骨作用或由骨基質中釋出。近幾年來，血中骨鈣蛋白質濃度顯示與骨形成時的組織形態學標記有關，現今更廣泛用為骨母細胞活性的指標。

近來的研究顯示：雖然骨鈣蛋白質真正的機轉仍不清楚，但推論在骨骼形成時，骨鈣蛋白質扮演著負向的調節作用，且不會改變蝕骨作用或骨的礦物質化，

Matrix Gla Protein

不同於骨鈣蛋白質(osteocalcin)只與骨的礦物質化有關，存在於軟骨及許多骨外軟組織中，含有 5 個 Gla 殘基的 matrix Gla protein，主要參與骨基質的非礦物化。Matrix Gla protein 的合成受活性維生素 D 及 retinoic acid 的調節；研究顯示：matrix Gla protein 在心臟、肺臟、腎臟、脾臟及肝臟內的量高於顱頂骨；另人類動脈粥狀硬塊中亦發現 matrix Gla protein 的存在。如同骨鈣蛋白質(osteocalcin)，幾年來對 matrix Gla protein 的生理機能仍然模糊不

清，由於存在許多軟組織中，Price 假設其作用為抑制軟組織的礦物質化。Luo 等人近來研究缺乏 matrix Gla protein 的老鼠會因主動脈及動脈的鈣化，導致血管破裂致死，證實了 matrix Gla protein 可抑制軟組織的鈣化。此外，缺乏 matrix Gla protein 亦會引起軟骨生長板不正常鈣化及導致身材短小、骨質稀少及骨折。

Protein S

雖先前已證實 protein S 在血液凝固中的角色，但直到 1990 年 Pan 等人發現在嚴重骨質稀少、骨礦物質減少及脊椎骨壓迫性骨折的小孩身上，明顯缺乏 protein S 後，才顯示 protein S 在骨的代謝中有其意義。自此，在人類骨基質的蛋白抽取物中可發現到 protein S 的存在，且人類骨肉瘤細胞珠及類骨母細胞亦可分泌 protein S；但其於骨中真正的角色仍待確立。

其他維生素 K 依賴性的蛋白質

Plaque Gla Protein

1979 年 Levy 等人從動脈粥狀硬塊中分離出含有 Gla 的蛋白質，命名為：atherocalcin，但後來證實此種蛋白只是白蛋白與骨鈣蛋白質的混合物。1990 年 Gijbers 等人分離出含有 5 個 Gla 殘基，分子量為 23000 Da 的蛋白質，命名為：plaque Gla protein。此蛋白質是否與 matrix Gla protein 相關仍需證實，而其真正的生理功能目前並不清楚。

Nephrocalcin

1970 年代後期 Hauschka 等人證實 γ -carboxyglutamic acid (Gla) 為腎臟組織的成分，幾年之後由腎臟及尿液中分離出含有 2-3 個 Gla 殘基的醣蛋白：nephrocalcin，此蛋白可抑制單氫氧基草酸鈣結晶的擴

大。雖然 nephrocalcin 可能在腎小管鈣處理上扮一角色，但 Worcester 等人的研究並不支持此項說法。

Gas6

1993 年 Manfioletti 等人發現一種新的維生素 K 依賴性蛋白質：gas6，為生長停止專一基因 6 的產物；分子量高 (75000 Da)，含有 11-12 個 Gla 殘基的蛋白質，結構類似 protein S。Gas6 存於許多軟組織中，於心臟、肺臟、胃及腎臟含量相當高，近來亦發現存於軟骨及人體的軟骨細胞中。藉由 Gla 殘基的特性，gas6 可作為許多受體蛋白活化酵素(如：Axl, res/Tyro3/Sky, Mer) 的配合基，雖然 gas6 真正的作用機轉尚未確立，但相信其可調節細胞的增生。Nakano 等人經一系列的研究實驗顯示：gas6 能加強血管平滑肌細胞的增生並預防細胞的死亡。

PRGP 1 及 PRGP 2

1997 年 Kulman 等人發表他們繁殖出兩種維生素 K 依賴性蛋白質，推論其分子量為 23000 及 17000 Da，富含脯酸(proline)，稱為 PRGP 1 及 PRGP 2 (proline-rich Gla proteins)。兩者廣泛分佈於組織中，PRGP 1 主存於脊椎，PRGP 2 主存於甲狀腺；其生理功能仍待確立。

結論

表一顯示維生素 K 依賴性蛋白質的種類及其生理功能。由於發現了這些與血液凝固無關的維生素 K 依賴性蛋白質，使維生素 K 更顯其生理機能的重要性，雖然某些蛋白質真正的作用機轉尚未確立，但最終也許能與營養建議有所牽連。

醫藥文獻新知摘要選粹

本欄專為本院醫藥同仁而設，由藥劑部及圖書館現有的期刊資料，每期摘要據有臨床啓發性之文章，或藥理治療新知等等。供大家參考，希望有興趣者，多多利用這些期刊。

中文標題：Minocycline用於類風濕性關節炎的益處及危險性

英文標題：Benefits and Risks of Minocycline in Rheumatoid Arthritis

原文出處：Drug Safety 2000 May;22(5)405-414

摘要內容：

類風濕性關節炎(RA)為一慢性發炎性疾病，影響大約1%的成人族群，各種的藥物被應用於治療此疾病，包括NSAIDs、類固醇及所謂的疾病修飾藥物(antimalarials, sulfasalazine, gold salts, methotrexate、cyclosporine及生物製劑等)，但仍有約10%患者的疾病會持續進展至永久的關節破壞。真正引起RA的病因及T細胞、自體免疫抗體、細胞素在疾病過程的角色並不清楚，而推論感染性病因亦佔一角色，因此許多抗微生物製劑(如：磺氨藥、四環黴素及 rifampicin)被研究用於治療RA。近幾年 minocycline 被廣泛研究於RA的治療，minocycline 為一半合成的四環黴素衍生物，其抗風濕的作用主非源自於抗菌效果，而是導因於抗發炎及免疫調節作用，研究顯示：minocycline 可①抑制 matrix metalloproteinases，而此酵素在破壞軟骨及骨骼上佔重要的角色；②抑制軟骨后及滑膜液 collagenase 的活性，可壓抑蝕骨作用；③抑制發炎反應中的 phospholipase A2；④影響滑膜液 T 細胞的增生及細胞素的產生。本篇引述三個使用 minocycline 治療初期(小於1年病史)類風濕性關節炎的雙盲研究，結果顯示：minocycline 200mg/天，可明顯的改善病患臨床及實驗室的數據(如：關節腫脹、疼痛、紅血球沉降速率等)；而 minocycline 可用於治療類風濕性關節炎，尤其在疾病的早期。(曾碧萊總藥師)

中文標題：局部使用甲基水楊酸會增強 warfarin 的抗凝血作用

英文標題：Potential of warfarin anticoagulation associated with topical methyl salicylate

原文出處：The Annals of Pharmacotherapy 2000;34(6):729-33

摘要內容：

甲基水楊酸(白株樹抽取的油)是各種市售解除骨骼肌肉疼痛的外用製劑之活性成份，醫學文獻對此類製劑均有警語：可能引起水楊酸中毒或增加使用 warfarin 病患的抗凝血作用

；但仍有許多醫療人員及病患會忽略此種局部使用的藥物。本篇敘述一位22歲因上腔靜脈栓塞經放置支架而需長期使用warfarin（每週8.5mg/天×4天，另3天服用9.5mg/天）的病患，其INR均維持在2.4-4.0，後因膝部疼痛每晚使用外用製劑（7%menthol+ 0.05%methyl salicylate），共用8天，造成瘀青及牙齦出血，INR增加至12.2，需要Vit K epoxide reductase，降低Vit K 依賴性凝血因子II、VII、X的活性；壓抑肝臟prothrombin的形成②水楊酸會自蛋白結合處取代出warfarin，使游離態warfarin濃度增加，造成暫時性的抗凝作用增強，但經過10-14天後，血液中warfarin會達一新的平衡狀態，便不會再增強抗凝作用；本篇所述之患者作用機轉較似此項。

市售的外用水楊酸製劑的強度有多種（<1%~55%），雖然文獻並未顯示藥物濃度的高低與抗凝作用得強弱相關連，但病患應告知此藥的全身吸收性及可能導致出血；另使用的增加、塗抹範圍擴大、使用軟膏基劑、加熱、按摩及運動均可能增加藥物的吸收，應多加注意。（曾碧萊總藥師）

中文標題：與Ceftriaxone相關之腎石病及膽性假結石

英文標題：Ceftriaxone-associated nephrolithiasis and biliary pseudolithiasis

原文出處：Eur J Pediatr(1999)158:975-977

摘要內容：

接受Ceftriaxone治療的病人得到膽的假結石已經被報導過，除了會形成膽沙之外，偶爾也有Ceftriaxone引起腎石病的報告被發表過，一般而言這種副作用將在開始治療細菌性腦膜炎4天後發生與Ceftriaxone有關之膽假石以及腎石病，當病人接受高劑量Ceftriaxone治療時發生腹部絞痛，就應考慮超音波檢察，以及更換適當抗生素治療。（李沐芬藥師）

中文標題：Rifapentine:It's role in the treatment of Tuberculosis

英文標題：Rifapentine用於治療結核病的角色

原文出處：The Journal of pharmacy Technology.

3/4 2000,Volume 16, No2, pp35-40

摘要內容：

本文搜集Medline 1966-1998年間的文獻資料，比較Rifapentin,Rifampin,isoniazid, pyrazinamide用於治療結核病的效果及副作用評估。已知Rifapentin是一Rifampin的cyclopentyl衍生物。在急性期，每週口服2次，每次600mg，維持劑量則每週一次即可。比Rifampin可增加病人服藥的順從性及降低藥價成本。且本藥耐受性良好，副作用與Rifampin相當，但比Rifampin較不會引起誘發肝酵素Cytochrome P450，故與其他藥的交互作用較少。

Rifapentin比Rifampin有更長的作用時間，與食物並用，可增加生體可用率。不可單獨使用，易產生耐藥性，仍建議與其他結核病藥並用。Rifapentin在1999年FDA核准為孤兒藥。早期的研究顯示Rifapentin效果比Rifampin差，但最新的研究顯示，增加劑量即可克服此問題。（曾淑鈺總藥師）