

核准日期：2006 年 06 月 18 日

修改日期：2006 年 08 月 04 日

## 乳酸左氧氟沙星氯化钠注射液说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

### 【药品名称】

通用名称：乳酸左氧氟沙星氯化钠注射液

英文名称：Levofloxacin Lactate and Sodium Chloride Injection

汉语拼音：Rusuan Zuoyangfushaxing Lühuana Zhusheye

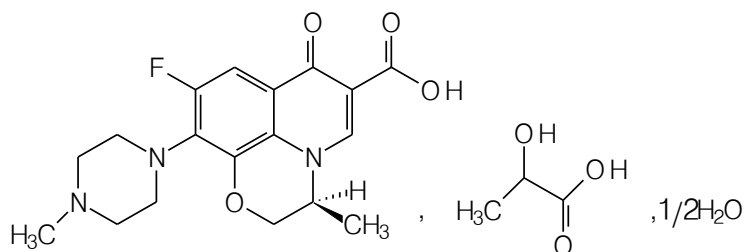
【成份】每 100ml 含乳酸左氧氟沙星 0.1g(以左氧氟沙星计)与氯化钠 0.9g;

每 100ml 含乳酸左氧氟沙星 0.2g(以左氧氟沙星计)与氯化钠 0.9g;

乳酸左氧氟沙星：

化学名称：(S)-(-)-9-氟-2, 3-二氢-3-甲基-10-(4-甲基-1-哌嗪基)-7-氧代-7H-吡啶并[1, 2, 3-de][1,4]-苯并噁嗪-6-羧酸乳酸盐半水合物。

化学结构式：



分子式：C<sub>18</sub>H<sub>20</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub> · C<sub>3</sub>H<sub>6</sub>O<sub>3</sub> · 1/2H<sub>2</sub>O

分子量：460.41

辅料：注射用水

### 【性状】

本品为微黄绿色的澄明液体。

【适应症】本品适用于敏感细菌所引起的下列中、重度感染：

呼吸系统感染：急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作、弥漫性细支气管炎、支气管扩张合并感染、肺炎、扁桃体炎（扁桃体周脓肿）；

泌尿系统感染：肾盂肾炎、复杂性尿路感染等；

生殖系统感染：急性前列腺炎、急性附睾炎、宫腔感染、子宫附件炎、盆腔炎（疑有厌氧菌感染时可合用甲硝唑）；

皮肤软组织感染：传染性脓疱病、蜂窝组织炎、淋巴管（结）炎、皮下脓肿、肛周脓肿等；

肠道感染：细菌性痢疾、感染性肠炎、沙门菌属肠炎、伤寒及副伤寒；

败血症、粒细胞减少及免疫功能低下患者的各种感染；

其他感染：乳腺炎、外伤、烧伤及术后伤口感染、腹腔感染（必要时合用甲硝唑）、胆囊炎、胆管炎、骨与关节感染以及五官科感染等。

【规格】（1）100ml：乳酸左氧氟沙星 0.1g（以左氧氟沙星计）与氯化钠 0.9g

【用法用量】静脉滴注。成人一次 0.1~0.2g,一日 2 次，或遵医嘱；重症感染患者和病原菌对本品敏感性较差者（如绿脓杆菌），每日最大剂量可增至 600mg,分 2 次静滴。

本制剂仅供静脉滴注，滴注时间为每 100ml 至少静脉滴注 60 分钟，滴速过快易引起静脉刺激症状或中枢神经系统反应。

**【不良反应】** 用药期间可出现恶心、呕吐、腹部不适、腹泻、食欲不振、腹痛、腹胀等症状；失眠、头晕、头痛等神经系统症状；皮疹、瘙痒、红斑及注射部位发红、瘙痒或静脉炎等症状。亦可出现一过性肝功能异常。如血转氨酶增高、血清总胆红素增加等。偶见血中尿素氮上升、倦怠、发热、心悸、味觉异常及注射后出现血管刺激症状等，一般多能耐受，疗程结束后多可消失。

**【禁忌】** 对喹诺酮类药物过敏者、癫痫患者、妊娠及哺乳期妇女、18岁以下患者禁用。

**【注意事项】**

1. 肾功能不全者应减量或慎用。
2. 有中枢神经系统疾患者慎用。
3. 本制剂不宜与其他药物同瓶混合静滴，或在同一根静脉输液管内进行静滴。
4. 喹诺酮类药物尚可引起少见的光毒性反应（发生率<0.1%）。在接受本品治疗时应避免过度阳光曝晒和人工紫外线。如出现光敏反应或皮肤损伤时应停用本品。此外偶有用药后发生跟腱炎或跟腱断裂的报告，故如有上述症状发生时须立即停药并休息，严禁运动，直至症状消失。
5. 性病患者治疗时，应进行梅毒血清学检查，以免耽误对梅毒的治疗。

**【孕妇及哺乳期妇女用药】** 1. 因不能确保妊娠妇女的用药安全，妊娠或有可能妊娠的妇女禁用。2. 因药物经乳汁排泄，所以哺乳期妇女禁用。如必须服用本药应暂停哺乳。

**【儿童用药】** 在动物实验（幼犬、幼成犬、幼鼠）中发现本品对承重关节有异常损伤，故18岁以下的患者禁用。

**【老年用药】** 本品主要经肾脏排泄（参见“药代动力学”），因高龄患者大多肾功能低下，可能会出现持续高血药浓度。因此，应注意用药剂量慎重给药。

**【药物相互作用】**

- 1、本品不能与多价金属离子如镁、钙等溶液在同一输液管中使用。
- 2、本品与苯丙酸、联苯丁酮酸类、非甾体类抗炎镇痛合用，可引发痉挛，应避免合用；
- 3、避免与茶碱同时使用。如需同时应用，应监测茶碱的血药浓度以调整其剂量。
- 4、与华法林或其衍生物同时应用时，应监测凝血酶原时间或其它凝血试验。
- 5、与口服降血糖药同时使用时可能引起低血糖，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。

**【药物过量】** 喹诺酮类药物过量时，可出现以下症状：恶心、呕吐、胃痛、胃灼热、腹泻、口渴、口腔炎、蹒跚、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、谵妄、小脑共济失调、颅内压升高（头痛、呕吐、视神经乳头水肿症状）、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、溶血性贫血、血尿、软骨/关节障碍、白内障、视力障碍、色觉异常及复视。

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，尿碱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：给予呋喃苯氨酸注射液；（3）对症疗法：抽搐时应反复投以安定静脉注射液；（4）重症：可考虑进行血液透析。

**【药理毒理】**

**药理作用**

左氧氟沙星为氧氟沙星的左旋体，其抗菌活性约为氧氟沙星的两倍，它的主要作用机理是通过抑制细菌 DNA 旋转酶（细菌拓扑异构酶）的活性，阻碍细菌 DNA 的复制从而达到抗菌作用。

本品具有抗菌谱广，抗菌作用强的特点，对大多数肠杆菌科细菌，如大肠埃希菌、克雷伯菌属、沙雷氏菌属、变形杆菌属、志贺菌属、沙门氏菌属、枸橼酸杆菌、不动杆菌属以及铜绿假单胞菌、流感嗜血杆菌、淋球菌等革兰氏阴性细菌有较强的抗菌活性。对部分甲氧西林敏

感葡萄球菌、肺炎链球菌、化脓性链球菌、溶血性链球菌等革兰氏阳性菌和军团菌、支原体、衣原体也有良好的抗菌作用，但对厌氧菌和肠球菌作用较差。

#### 毒理研究

重复给药毒性：大鼠连续 4 周经口给予左氧氟沙星剂量分别为 50、200、800mg/kg,仅见 800mg/kg 用药组动物出现中性白细胞的减少和骨髓 M/E 的上升；病理组织学可见肢关节表面出现轻度变性。猕猴经口给药 4 周，100mg/kg 组动物出现流涎、腹泻、体重轻度下降和尿中 pH 值降低。大鼠经口给药 26 周，80 和 320mg/kg 剂量组动物出现流涎、尿中 pH 值升高。320mg/kg 组动物的排粪量增加，盲肠粘膜的杯状细胞出现肿大。猕猴经口给药 26 周时，在 10、25、62.5mg/kg 剂量下均未出现明显毒性反应。

对关节软骨的影响：幼年和 3-4 周龄大鼠、4 月龄猎兔犬经口给药 7 天，大鼠在 300mg/kg 以上、猎兔犬在 10mg/kg 以上剂量时，出现关节软骨病变，并在幼、年轻猎兔犬中易发现关节毒性。13 月龄犬，经口给药 7 天，在 40mg/kg 剂量时出现极轻度的关节毒性。但 18 月龄犬静脉注射 14 天，30mg/kg 剂量时未出现关节毒性。

生殖毒性：大鼠妊娠前，妊娠初期经口给药剂量达 360mg/kg 时，对雌、雄动物的生殖能力和胎儿均未见影响。大鼠在器官形成期给药，剂量达到 90mg/kg 时，对胎儿和新生儿均无明显影响。家兔经口给药 50mg/kg 时，未出现胚胎、胎儿致死以及胎儿生长迟缓作用，也未出现致畸作用。大鼠围产期、授乳期经口给药达到 360mg/kg 时，对动物的分娩、授乳以及出生儿均未见明显影响。

光毒性:采用长波长紫外线（320-400nm）照射，以小鼠耳廓厚度变化为指标进行了光毒性研究，结果经口给药剂量达 200mg/kg 时，未见明显异常变化。

【药代动力学】国内健康人恒速静脉滴注乳酸左氧氟沙星注射液 0.2g(以 C<sub>18</sub>H<sub>20</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub> 计)，滴注时间为 1 小时，血药峰浓度 (C<sub>max</sub>) 为 3.40 (2.8~4.0) μg/ml，12 小时后血药浓度为 0.55 (0.3~0.7) μg/ml，消除相半衰期 (t<sub>1/2β</sub>) 约为 5.2 小时，清除率 (CL) 约 11.2L/h。尚缺乏静脉滴注乳酸左氧氟沙星注射液 0.3g 的人体药代动力学资料。

国外资料单次静注左氧氟沙星 300 mg 和相同剂量口服给药的药代动力学参数相似（见表）。左氧氟沙星 300mg 静注 (n=8) 和口服 (n=12) 后药代动力学参数的平均值

给药途径	C <sub>max</sub> (μg/ml)	AUC(0-24) (μg.h/ml)	T(1/2) (h)	肾清除率 (ml/min)
静注	6.27	20.73	6.28	145.55
口服	4.04	22.62 [AUC(0-48)]	6.48	162.80

多剂量研究中 (300mg 每日两次静脉滴注，共 6 天) 其血药浓度于 24-48 小时达稳态。首次及末次剂量后的血药浓度分别为 5.35 和 6.12μg/ml，表明无明显蓄积。

左氧氟沙星在体内组织中分布广泛。主要以原型药由尿中排出，口服给药后 48 小时内，尿中原型药排出量约占给药量的 87%；72 小时内粪便中的排出药量少于给药量的 4%；约 5% 的药物以无活性代谢物的形式由尿中排出。

肾功能减退的患者左氧氟沙星清除率下降，消除半衰期延长，为避免药物蓄积，应进行剂量调整。血液透析和连续腹膜透析 (CAPD) 不影响左氧氟沙星从体内排出。

【贮藏】遮光，密闭，在阴凉（不超过 20℃）干燥处保存。

【包装】玻璃输液瓶包装，100ml/瓶。

【有效期】24 个月

【执行标准】国家食品药品监督管理局管理标准 YBH17962006

【批准文号】国药准字 H20066024。

【生产企业】企业名称：江苏亚邦生缘药业有限公司

生产地址：江苏省滨海经济开发区环区路 62 号

邮政编码：224500

电话号码：0515-84191801 84191906

传真号码：0515-84105768

网址：<http://www.yabang.biz>