

核准日期: 2006 年 10 月 12 日
修改日期: 2011 年 06 月 14 日
2017 年 08 月 28 日
2021 年 06 月 10 日
2023 年 06 月 05 日



乳酸司帕沙星片说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用
严禁用于食品和饲料加工

警告

严重不良反应, 包括肌腱炎和肌腱断裂, 周围神经病变, 中枢神经系统的影响和重症肌无力加剧。

- 使用氟喹诺酮类药品 (包括乳酸司帕沙星), 已有报告同时发生致残和潜在的不可逆转的严重不良反应 (参见【注意事项】), 包括:
 - 肌腱炎和肌腱断裂 (参见【注意事项】)
 - 周围神经病变 (参见【注意事项】)
 - 中枢神经系统的影响 (参见【注意事项】)

当发生这些严重不良反应 (参见【注意事项】), 应立即停用乳酸司帕沙星并避免使用氟喹诺酮类药品。

- 氟喹诺酮类药品可能会加剧重症肌无力患者的肌无力症状。已知有重症肌无力病史的患者应避免使用乳酸司帕沙星 (参见【注意事项】)。
- 由于使用氟喹诺酮类药品 (包括乳酸司帕沙星) 已有报道发生严重不良反应 (参见【注意事项】), 对于属于下列适应症的患者, 应在没有其它药品治疗时方可使用乳酸司帕沙星:
 - 急性细菌性鼻窦炎 (参见【适应症】和【用法用量】)
 - 慢性支气管炎急性发作 (参见【适应症】和【用法用量】)
 - 单纯性尿路感染 (参见【适应症】和【用法用量】)
 - 急性非复杂性膀胱炎 (参见【适应症】和【用法用量】)

【药品名称】

通用名称: 乳酸司帕沙星片
商品名称: 力贝尔
英文名称: Sparfloxacin Lactate Tablets
汉语拼音: Rusuan Sipaxing Pian

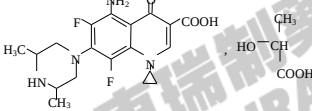
【成份】

活性成份: 乳酸司帕沙星

化学名称: 5-氨基-1-环己基-7-(顺-3, 5-二甲基-1-哌嗪基)-6,

8-二氟-1, 4-二氢-4-喹-喹啉-3-羧酸乳酸盐。

化学结构式:



分子式: $C_{19}H_{22}F_2N_4O_3$

分子量: 482.49

【性状】

本品为薄膜衣片, 除去包衣后显黄色。

【适应症】

本品可用于由敏感菌引起的轻、中度感染, 包括

- 呼吸道感染: 如急性咽炎、急性扁桃腺炎、中耳炎、鼻窦炎、支气管炎、支气管扩张合并感染、肺炎等; 由于使用氟喹诺酮类药品 (包括乳酸司帕沙星) 已有报道发生严重不良反应, 且对于一些患者, 急性细菌性鼻窦炎/慢性支气管炎急性发作有自限性, 应在没有其它药物治疗时方可使用乳酸司帕沙星。

- 肠道感染: 如细菌性痢疾、伤寒、感染性肠炎、沙门氏菌肠炎等;

- 胆道感染: 如胆囊炎、胆管炎等;
- 泌尿生殖系统感染: 如膀胱炎、肾盂肾炎、前列腺炎、淋菌性尿道炎、非淋菌性尿道炎、子宫附件炎、子宫内感染、子宫颈炎、前庭大腺炎等及由溶脲原原体、沙眼衣原体所致的泌尿生殖道感染; 由于使用氟喹诺酮类药品 (包括乳酸司帕沙星) 已有报道发生严重不良反应, 且对于一些患者, 单纯性尿路感染/急性非复杂性膀胱炎有自限性, 应在没有其它药物治疗时方可使用乳酸司帕沙星。

- 皮肤、软组织感染: 如脓疱疮、家族性痤疮、毛囊炎、疖、疖、疖、丹毒、蜂窝组织炎、淋巴结炎、淋巴管炎、皮下脓肿、汗腺炎、毛囊炎、外伤及手术伤口感染等;
- 口腔科感染: 如牙周组织炎、牙周炎、牙龈炎、咽炎等。

【规格】

0.1 g (以 $C_{19}H_{22}F_2N_4O_3$ 计)

【用法用量】

口服, 成人每次 0.1~0.3 g, 最多不超过 0.4 g, 每日一次, 疗程一般 4~7 天, 可根据病种及病情适当增减疗程, 或遵医嘱。

【不良反应】

司帕沙星可能引起下列反应:

严重和其他重要的不良反应

- 致残和潜在的不可逆转的严重不良反应, 包括肌腱炎和肌腱断裂, 周围神经病变, 中枢神经系统的影响
- 肌腱炎和肌腱断裂
- QT 间期延长
- 过敏反应
- 其他严重并且有时有致命的影响
- 中枢神经系统的影响
- 艰难梭菌相关性腹泻
- 周围神经病变
- 对血糖的干扰
- 光敏性/光毒性
- 主动脉瘤和主动脉夹层的风险

在【注意事项】下对以上不良反应进行了详细说明。

消化系统反应: 如恶心、呕吐、食欲不振、上部不适、软便、腹泻、腹胀、便秘、便血、口腔炎等;

心血管系统: QT 间期延长、尖端扭转型室性心动过速、室性心律失常;

中枢神经系统: 头痛、眩晕、惊厥、中毒性精神病、震颤、躁动、焦虑、头晕、意识模糊、幻觉、妄想、抑郁、恶梦、失眠、癫痫发作、极少数情况可导致患者产生自杀的念头或行为;

周围神经病变: 感觉错误、感觉迟钝、触痛感、疼痛、烧灼感、麻刺感、麻木、无力、或轻触觉、痛觉、温度觉、位置觉和振动觉异常、多发性神经炎;

骨骼肌肉系统: 关节痛、肌痛、肌无力、张力亢进肌腱炎、肌腱断裂、重症肌无力恶化;

超敏反应 (含光敏反应): 皮疹、发热、局部发红、水肿、水泡、红斑、充血、荨麻疹、瘙痒及其他严重皮肤反应 (如中毒性表皮坏死脱落症、多形性红斑)、呼吸困难、血管神经性水肿 (包括舌、喉、咽或面部水肿/肿胀)、心血管性虚脱、低血压、意识丧失、气道阻塞 (包括支气管痉挛、气促及急性呼吸窘迫)、过敏性肺炎、过敏性休克;

肝胆系统: 肝炎、黄疸、急性肝坏死或肝衰竭;

泌尿系统: 急性肾功能不全或肾衰;

血液系统: 贫血, 包括溶血性贫血和再生障碍性贫血、血小板减少症、包括血栓性血小板减少性紫癜、白细胞减少症、粒细胞减少症、全血细胞减少症和/或其他血液病;

其他: 发烧、血管炎、血精病、难辨梭菌相关性腹泻、糖尿病紊乱、光敏性/光毒性、偶见肌腱炎、伪膜性肠炎、间质性肺炎、休克、过敏综合征 (呼吸困难、浮肿、声音嘶哑、潮红、瘙痒等)、眼结膜综合征 (史蒂文斯-约翰逊综合征)、低血糖、麻木感、不舒服感、疲倦感等;

实验室检查: 本品可致 AST、ALT、ALP、LDH、BUN、Cr 及总胆红素升高, 也可致嗜碱性粒细胞增多及白蛋白、红蛋白、血红蛋白和白小板降低等; 国外有 QT 轻度延长的报告。

【禁忌】

对喹诺酮类药物过敏者、孕妇、哺乳期妇女及 18 岁以下患者禁用。

【注意事项】

1. 肝、肾功能异常者应慎用或适当降低剂量;

2. 服用本品后分枝链核杆菌检查可能呈假阳性。

3. 致残和潜在的不可逆转的严重不良反应, 包括肌腱炎和肌腱断裂, 周围神经病变, 中枢神经系统的影响。

使用氟喹诺酮类药品, 已有报告在同一患者的身体不同器官系统同时发生致残和潜在的不可逆转的严重不良反应, 通常包括: 肌腱炎, 肌腱断裂, 关节痛, 肌痛, 周围神经病变和/或中枢神经系统反应 (幻觉, 焦虑, 抑郁, 失眠, 严重头痛和错觉)。这些不良反应可发生在在使用乳酸司帕沙星后数小时至数周。任何年龄段的患者, 之前没有相关风险因素, 均有报告发生这些不良反应。

4. 肌腱病和肌腱断裂

氟喹诺酮类药品, 会使所有年龄段患者的肌腱炎和肌腱断裂的风险增加。这种不良反应最常发生在跟腱, 跟腱断裂可能需要手术修复。也有报告在肩、手部、肘、腕、拇指和其他肌腱点出现肌腱炎和肌腱断裂。肌腱炎和肌腱断裂可发生在开始使用乳酸司帕沙星后数小时或数天, 或结束治疗后几个月。肌腱炎和肌腱断裂可双侧发生。这种风险在 60 岁以上老年患者, 服用皮质类固醇药品患者及肾脏、心脏或肺移植手术的患者中进一步增加。除了年龄和使用皮质类固醇的因素外, 另可独立增加肌腱断裂风险的因素包括剧烈的体力活动、肾功能衰竭以及以前的肌腱病、如类风湿关节炎。肌腱炎和肌腱断裂也发生在没有上述风险因素的使用氟喹诺酮类药品的患者中。数月后发生肌腱断裂, 在患者发生肌腱疼痛、肿胀、炎症或断裂后, 应停止使用本品。在出现肌腱炎或肌腱断裂的迹象后, 应建议患者休息, 并与医生联系, 换用非氟喹诺酮类药品。有肌腱病病史或发生过肌腱炎和肌腱断裂的患者应避免使用氟喹诺酮类药品。

5. 重症肌无力加重

氟喹诺酮类药品, 有神经肌肉阻断活性, 可能加剧重症肌无力患者的肌无力症状。上市后的严重不良事件, 包括死亡和需要通气支持, 以及重症肌无力患者与使用氟喹诺酮类药品相关。患有重症肌无力的患者应避免使用乳酸司帕沙星。

6. QT 间期延长

某些氟喹诺酮类药品可以使心电图的 QT 间期延长, 少数患者可以出现心律失常。上市后监测自发报告接受氟喹诺酮类药品治疗的患者出现尖端扭转型室速的情况罕见。已知 QT 间期延长的患者、未纠正的低血钾患者及使用 1A 类 (奎尼丁、普鲁卡因胺)

和Ⅲ类（胺碘酮、索他洛尔）抗心律失常药品的患者应避免使用乳酸司帕沙星。老年患者更容易受药品相关的QT间期的影响。

7.过敏反应

使用氟喹诺酮类药品，已报告发生严重的过敏反应。一些患者在接受第一次给药后即发生，有些反应可伴随有心血管系统衰竭、丧失意识、刺痛、咽部或面部水肿、呼吸困难、荨麻疹、瘙痒等。严重的过敏反应如需要上酸素紧急治疗。乳酸司帕沙星应在第一次出现皮疹或其他任何过敏反应时停止使用。必要时可进行输氧，静脉注射类固醇，气道管理，包括插管等措施。

其他严重并且可能致命的事件

使用氟喹诺酮类药品，已有出现其他严重并且可能致命的事件报告。这些事件中有些是由于过敏，有些则因不明。这些事件可能是严重的，通常发生在多次剂量给药后。临床表现可包括以下的一个或多个症状：发热、皮疹、严重的皮肤反应（例如，中毒性表皮坏死脱落症，Stevens-Johnson 综合征）；血管炎；关节痛；肌痛；血痛；过敏性肺炎；间质性肾炎；急性肾功能不全或肾衰竭；肝炎、黄疸、急性肝坏死或肝功能衰竭，贫血，包括溶血性贫血和再生障碍性贫血；血小板减少症，包括血小板减少性紫癜；粒细胞减少症；粒细胞缺乏症；全血细胞减少症和/或其他血液学异常。应在第一次出现皮肤、黄疸或任何其他过敏反应时立即停药并且采取措施。

9.中枢神经系统的影响

使用氟喹诺酮类药品，包括乳酸司帕沙星，已有报告会使中枢神经系统不良反应增加的风险，包括惊厥和颅内压增高（含假性脑瘤）以及中毒引起的精神病。使用氟喹诺酮类药品可能会导致中枢神经系统反应包括癫痫、激动、失眠、焦虑、噩梦、偏执、头晕、错乱、震颤、幻觉、抑郁和自杀想法或行为。这些反应可能发生在首次用药时。如果这些反应发生在患者使用乳酸司帕沙星时，应停止给药并采取适当的措施。与所有的氟喹诺酮类药品一样，已知或怀疑有中枢神经系统疾病的患者（如严重的脑动脉硬化、癫痫）或存在其他危险因素的患者（如有发作倾向或发作阈值降低）应在获益超过风险时使用乳酸司帕沙星。

10.周围神经病变

已有报告患者使用氟喹诺酮类药品，产生罕见的感觉或感觉运动性轴索神经病，影响小和/或大的轴索，皮肤感觉异常、感觉迟钝、触物痛感和衰弱。对于某些患者，症状可能在乳酸司帕沙星用药后很快发生并且可能是不可逆的。如果患者出现外周神经病变症状，包括疼痛、烧灼感、麻木和/或无力，或其他感觉，包括轻触觉、痛觉、温度觉和运动觉的变化，应立即停药。有周围神经病变病史的患者应避免使用氟喹诺酮类抗生素。

11.艰难梭菌相关性腹泻

几乎所有的抗菌药品均出现过艰难梭菌相关性腹泻（CDAD）的报告，包括乳酸司帕沙星，严重程度从轻度腹泻至严重结肠炎。抗菌药品治疗使结菌的正常菌群改变，从而导致艰难梭菌过度生长。

艰难梭菌产生的毒素A和B，是艰难梭菌相关性腹泻的原因。高毒性的菌株引起发病率和死亡率均升高，这些感染抗菌药均无效，并可能需要结肠切除术。在接受抗生素治疗时，出现腹泻均应考虑CDAD的可能性。因为CDAD可能发生在使用抗菌药品治疗后两个月，因此任何询问病史是必要的。

如果怀疑或证实艰难梭菌相关性腹泻，可能需要停止目前使用的针对艰难梭菌的抗生素。应适当补充液体和电解质，补充电解质，采用针对艰难梭菌的抗生素治疗，出现临床指征时应进行手术评价。

12.对血糖的干扰

曾有氟喹诺酮类抗生素引起血糖紊乱（如症状性高血糖和低血糖）的报道，这种情况多发生于同时口服降糖药（如伏格列糖/格列本酮）或使用胰岛素的糖尿病患者。因此对于此类患者，建议应密切监测其血糖变化情况。如果患者在接受乳酸司帕沙星治疗时出现低血糖反应，应立即停药并采取适当的处理措施。

13.光敏感性/光毒性

在使用氟喹诺酮类抗生素后暴露于阳光或紫外线照射下，会发生中度至严重的光敏性/光毒性反应，后者可能表现过度的晒伤反应（例如皮肤灼伤、红斑、水泡、渗出、肿胀），常出现在暴露于光的部位（通常是颈部的“V”型区域、前臂伸肌面、手的背部）。因此，应避免过度暴露于光源下。发生光毒性反应时应停药，光过敏患者慎用或禁用。

14.主动动脉瘤和主动动脉夹的风险

流行病学研究报告使用氟喹诺酮类药物后两个月内主动动脉瘤和主动动脉夹的发生率增加，尤其是老年患者。风险增加的原因尚未确定。对于已知患有主动动脉瘤或主动动脉瘤高风险的患者，仅在在没有其他抗菌治疗可用情况下，使用乳酸司帕沙星。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

氟喹诺酮类可透过胎盘屏障，可分泌到乳汁中，其浓度接近血液浓度，孕妇及哺乳期妇女禁用。

【儿童用药】

18岁以下患者使用本品的安全性和有效性尚未建立，禁用本品。

【老年用药】

老年人慎用本品，若使用应适当降低剂量。

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

【药物相互作用】

1.同低钙治疗、诺氟沙星、环丙沙星一样，本品与非甾体类抗炎药（如苯丁酮酸、丙酸衍生物等）合用时，罕有引起痉挛的报告。

2.本品与含有铝、镁、铁的抗酸药和硫酸铝合用时，可降低本品的吸收，从而降低药效，如需用应间隔4小时。

3.本品与茶碱、咖啡因、华法林、西米替丁合用时不影响后者血浆浓度。

4.与地高辛、丙磺舒合用不影响本品的药代动力学。

5.服用本品4小时后才可服用含金属离子的营养剂和含锌、铁、钙的维生素。

6.本品不宜与阿司咪唑、特非那丁、西沙必利、红霉素、喷他肽、咯喹酮、三环类抗抑郁药、丙戊酸、胺碘酮合用。

【药物过量】

本品过量无已知的解毒剂。若过量，医生应进行包括心电图在内的监测，并在5天内避免接触日光、曝晒。

【药理作用】

药理作用

司帕沙星为广谱氟喹诺酮类抗生素，其作用机制为抑制细菌DNA旋转酶，从而阻碍DNA复制，产生杀菌作用。本品在化学结构上和作用形式上与β-内酰胺类抗生素不同，因此，对于β-内酰胺类抗生素耐药的细菌对本品仍敏感。尽管本品与其它氟喹诺酮类药物之间已发现交叉耐药性，但是某些对其它氟喹诺酮类药物耐药的微生物对本品仍敏感。

动物体内试验和临床感染治疗中证实：本品对下列细菌有抗菌活性：1.革兰氏阳性需氧微生物：金黄色葡萄球菌、肺炎链球菌（对青霉素敏感的菌株）、2.革兰氏阴性需氧微生物：大肠杆菌、流感嗜血杆菌、副流感嗜血杆菌、肺炎克雷伯杆菌、卡他莫拉菌。3.其它微生物：肺炎衣原体、肺炎支原体。

以下微生物尽管体外有抗菌作用，但是其临床意义尚不清楚：1.革兰氏阳性需氧微生物：无乳链球菌、肺炎链球菌（耐青霉素菌株）、化脓链球菌等。2.革兰氏阴性需氧微生物：硝酸盐阴性不动杆菌、鸟氏不动杆菌、弗罗因德枸橼酸杆菌、产气肠杆菌、脆弱克雷伯杆菌、嗜肺性军团菌、摩根菌、奇异变形杆菌、普通变形杆菌。

毒理研究

遗传毒性：本品对Ames试验中大多数鼠伤寒沙门菌株（TA100、TA1535、TA1537）、大肠杆菌WP2uvrA和中国仓鼠肺细胞均无致突变作用，但已证实本品和其它喹诺酮类的药物对鼠伤寒沙门菌株TA102的有致突变作用，并诱导大肠杆菌的DNA修复，这可能是因为这些药物抑制了细菌DNA旋转酶。本品在体外细胞毒试验中，可诱发中国仓鼠肺细胞染色体畸变，但是当经口给予小鼠本品后，未见染色体畸变或小鼠骨髓微核增加。

生殖毒性：以体表面积计算，大鼠、家兔和猴经口给予剂量分别为人最大剂量药量的6.4、4.4、2.6倍（猴和大鼠的血浆浓度分别高于人的4.5和6.5倍），未见致畸胎作用。本品在大鼠经口给予最大剂量药量（400mg）的15.4倍（以体表面积计算）（相当于人最大血浆浓度的12倍）时，对雌、雄动物的生育力或生殖功能无影响。以上剂量对家兔和猴的母体具有明显的毒性，对大鼠有轻度的母体毒性。当以出现明显母体毒性的剂量（以体表面积计，相当于人用最大剂量的9.3倍）给予怀孕大鼠，可见剂量依赖性的胚胎脑室中隔的缺损。在三种动物的试验中，该损伤对大鼠是特异性的。

致癌性：小鼠或大鼠分别连续104周每日经口给予相当于人最大剂量（400mg）的3.5-6.2倍（以体表面积计算）时，未发现致癌性。

其它：已证实未成年犬连续7天经口给予本品剂量为25mg/kg/day（以体表面积计算，约相当于人最高剂量的1.9倍）时，可引起关节炎，犬的负重关节出现小范围的软骨骨质性损伤。其他喹诺酮类的药物在不同种类的未成年动物中也可见此类变化和关节炎变的其它体征。

【药代动力学】

据文献资料介绍，司帕沙星口服后主要在小肠吸收，胃几乎不吸收。司帕沙星血浆蛋白结合率为42-44%。健康成人空腹单次口服200mg司帕沙星片时，服药后约4小时左右，血浆药物浓度达峰值，其值为0.58μg/ml，消除半衰期较长，约为16小时左右。高龄者单次口服150mg司帕沙星时，血浆药物浓度峰值为1.72μg/ml，平均消除半衰期(t_{1/2})为26小时左右。司帕沙星片口服吸收后体内分布广泛，主要分布于胆囊（约为血浆药物浓度的7倍）；其次为皮肤、前列腺、子宫、卵巢、耳、鼻、喉组织、痰液、前列腺液、尿液及乳汁中（约为血浆药物浓度的1.5倍）；再次为唾液、泪液（约为血浆药物浓度的0.7-0.8倍）；最低为眼房水及脊髓液。健康成人单次口服司帕沙星200mg后72小时，用药量的12%以原形药物及29%以葡萄糖醛酸共轭物从尿中排泄，51%以原形药物从粪便中排泄。

司帕沙星和抗酸剂（如氢氧化铝凝胶）合用与司帕沙星单独使用相比较，血浆半衰期大致相同，血浆药物浓度峰值及曲线下面积分别降低21%及35%。

健康成人及患者合用司帕沙星与茶碱时，司帕沙星不影响血浆中的茶碱浓度。

【贮藏】遮光，密封保存。

【包装】铝包袋装，6片/板×1板/盒、6片/板×2板/盒、6片/板×3板/盒、6片/板×4板/盒、12片/板×1板/盒。

【有效期】24个月。

【执行标准】WS₃-(X-135)-20052

【批准文号】国药准字H20020453

【上市许可持有人】

名称：苏州东瑞制药有限公司

地址：江苏省苏州吴中经济开发区民丰路268号

【生产企业】

企业名称：苏州东瑞制药有限公司

生产地址：江苏省苏州吴中经济开发区民丰路268号

邮政编码：215128

电话号码：0512-65626868

传真号码：0512-65626868

网 址：www.dawnrays.com

产品咨询热线：040 030 9000