

核准日期: 2006年10月12日  
修改日期: 2011年06月14日

 東瑞製藥  
DAWN RAYS

## 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**

### 【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: Rusan Sipashaxing Pian

### 【成份】

活性成份: 乳酸司帕沙星  
化学名称: 5-氨基-1-环丙基-7-(顺-3, 5-二甲基-1-哌嗪基)-6, 8-二氟-1, 4-二氢-4-氧-喹啉-3-羧酸乳酸盐。  
化学结构式:



分子式:  $C_{19}H_{22}F_2N_4O_3 \cdot C_3H_5O_3$

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

- 1、呼吸道感染: 如急性咽炎、急性扁桃体炎、中耳炎、鼻窦炎、支气管炎、支气管扩张合并感染、肺炎等;
- 2、肠道感染: 如细菌性痢疾、伤寒、感染性肠炎、沙门氏菌肠炎等;
- 3、胆道感染: 如胆囊炎、胆管炎等;
- 4、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、子宫膜炎、前庭大腺炎等及由溶脲脲原体、沙眼衣原体所致的泌尿生殖道感染;
- 5、皮肤、软组织感染: 如脓疱疮、集簇性痤疮、毛囊炎、疖、疖肿、疖、丹毒、蜂窝织炎、淋巴管炎、淋巴管炎、皮下脓肿、汗腺炎、乳腺炎、外伤及手术伤口感染等;
- 6、口腔科感染: 如牙周组织炎、牙周炎、颌炎等。

### 【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:

- 1、消化系统反应: 如恶心、呕吐、食欲不振、上腹部不适、软便、腹泻、腹胀、便秘、血便、口腔炎等;
- 2、过敏反应 (含光过敏反应): 如皮疹、发热、局部发红、水肿、瘙痒、水疱、红斑、充血等;
- 3、中枢神经系统: 头痛、头昏、烦躁、失眠、痉挛、震颤等;
- 4、实验室检查: 本品可致 AST、ALT、ALP、LDH、BUN、Cr 及总胆红素升高, 也可致嗜酸性粒细胞增多及白血球、红血球、血红蛋白和血小板降低等; 国外有 QT 轻度延长的报告;
- 5、其他: 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)、眼粘膜综合征 (史蒂文斯-约翰逊综合征)、低血糖、麻木感、不舒服感、疲倦感等。

### 【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、光过敏患者慎用或禁用;
- 2、用药期间, 应尽可能避免接触日光、暴晒。若有光过敏症状产生, 如皮疹、瘙痒、水疱等, 必须立即停药, 并给予适当治疗;
- 3、肝、肾功能异常者应慎用或适当降低剂量;
- 4、有癫痫病史及其他中枢神经系统疾病者慎用;
- 5、可能有 QT 延长的患者, 如心脏病患者 (心律不齐、缺血性心脏病等)、低钾血症、低镁血症以及服用抗心律失常药物者等, 应慎用本品;
- 6、服用本品后分枝结核杆菌检查可能呈假阴性。

### 【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, 其浓度接近血药浓度, 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】

高龄者慎用本品，若使用应适当降低用量。

## 【药物相互作用】

- 1、同依诺沙星、诺氟沙星、环丙沙星一样，本品与非甾体类抗炎药（如联苯丁酮酸、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，如需服用应间隔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、喷他脞、吩噻嗪、三环类抗抑郁药、丙吡胺、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。

## 【药物毒理】

### 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有交叉耐药性，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。

动物体外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、鲁氏不动杆菌、弗罗因德枸橼酸杆菌、产气肠杆菌、催产克雷伯杆菌、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。本品在体外细胞毒浓度下，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，未见染色体畸变数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用药剂量的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）时，未见致畸胎作用。本品在雌性大鼠给药量成人最大给药剂量（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，可引起关节病变，犬的负重关节出现小范围的软骨腐蚀性损伤。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病变的其它特征。

## 【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<sub>1/2</sub>)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）；最低为眼房水和脊髓液。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】

双铝包装，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】

WS<sub>1</sub>- (X-135)-2005Z

## 【批准文号】

国药准字H20020453

## 【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