

核准日期：2006 年 06 月 06 日

修改日期：2006 年 08 月 04 日

## 甲磺酸帕珠沙星注射液说明书

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：甲磺酸帕珠沙星注射液

商品名：加易尼

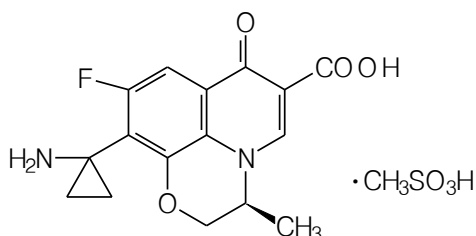
英文名称：Pazufloxacin Mesylate Injection

汉语拼音：Jiahuangsuan Pazhushaxing Zhushuye

【成份】本品活性成份为甲磺酸帕珠沙星。

化学名称：(-)-(3S)-10(1-氨基环丙基)9-氟-2, 3-二氢-3-甲基—7-氧-7H-吡啶并[1, 2, 3-de]-[1, 4]苯并 喹-6-羧酸甲磺酸盐。

化学结构式：



分子式：C<sub>16</sub>H<sub>15</sub>FN<sub>2</sub>O<sub>4</sub>·CH<sub>4</sub>O<sub>3</sub>S

分子量：414.41

辅料：注射用水。

【性 状】本品为微黄色澄明液体。

【适应症】本品适用于敏感细菌引起的下列感染：

- (1) 慢性呼吸道疾病继发感染，如慢性支气管炎、弥漫性细支气管炎、支气管扩张、肺气肿、肺间质纤维化、支气管哮喘、陈旧性肺结核等；肺炎，肺脓肿；
- (2) 肾盂肾炎、复杂性膀胱炎、前列腺炎；
- (3) 烧伤创面感染，外科伤口感染；
- (4) 胆囊炎、胆管炎、肝脓肿；
- (5) 腹腔内脓肿、腹膜炎；
- (6) 生殖器官感染，如子宫附件炎，子宫内膜炎；盆腔炎。

【规格】5ml：0.3g（以帕珠沙星计）

### 【用法用量】

用法：将本品 0.3g 用 100ml 0.9% 氯化钠注射液稀释后静脉滴注。

用量：一次 0.3g，一日二次，静脉滴注时间为 30~60 分钟，疗程为 7~14 天。可根据患者的年龄和病情酌情调整剂量。

给药注意事项：

- (1) 应用本品前应先做细菌学检查。一般来说，为防止细菌出现耐药，在感染的致病菌确定后，在保证病人治疗的情况下，应尽量减少给药时间。
- (2) 给药期间，不管有无必要继续用药，在开始给药 3 天后应判断继续用药的必要性，评估是否停用本药或改用其它药物。一般来说，本药最常用治疗疗程为 14 天。
- (3) 此药一般不可以与其它药物或输液剂混合使用。

(4) 严重肾功能不全者慎用或调整用药剂量或用药疗程。参考如下：

肾清除率 (ml/min)	给药剂量
44.7	一次 0.3g, 一日二次
13.6	一次 0.3g, 一日一次
透析患者	一次 0.3g, 3 天一次

#### 【不良反应】

本品主要临床不良反应为腹泻、皮疹、恶心、呕吐，实验室检查可见 ALT、AST、ALP、r-GTP 升高，嗜酸性粒细胞增加。

(1) 临床不良反应：

- 1) 急性肾功能衰竭：可能会引起急性肾功能衰竭。
- 2) 肝功能异常、黄疸。
- 3) 伪膜性肠炎：可发生伴有血便的严重的肠炎，如果出现腹痛或频繁的腹泻，应立即停药并采取相应的防治措施处理。
- 4) 粒细胞减少、血小板减少症。
- 5) 横纹肌溶解：如果出现肌痛、虚弱、磷酸肌酸激酶（CPK）升高、血或尿中的肌球素升高，应立即停药。横纹肌溶解也可导致急性肾功能衰竭。
- 6) 痉挛。
- 7) 休克、过敏反应，若出现呼吸困难、水肿、红斑等任何异常、应停止给药，并采取适当处理措施。
- 8) 表皮脱落坏死（Lyell 综合症），眼、粘膜、皮肤综合症（Stevens Johnson 综合症）。
- 9) 间质性肺炎：伴有发热、咳嗽、呼吸困难、胸部 X 片异常的肺炎发生。
- 10) 低血糖：严重低血糖，易发生于老年病人、肾功能衰竭病人，应仔细观察。
- 11) 跟腱炎、肌腱断裂。

给药期间应密切观察，如出现上述不良反应，应立即停药，并采取相应的处理措施。

(2) 同类药物的不良反应：

PIE 综合症：伴有发热、咳嗽、呼吸困难、胸部 X 片异常，嗜酸性粒细胞增多的 PIE 综合症，见于临床应用的其他新喹诺酮类药物报道，如出现上述不良反应立即停药，并采取相应的处理措施。

(3) 其它不良反应：

如观察到下列不良反应采取适当处理措施：

- 1) 过敏反应：皮疹、发热（发生率 0.1~5%），荨麻疹、瘙痒、面部皮肤潮红（发生率 <0.1%）。
- 2) 肾脏损害：BUN 升高、蛋白尿、胆红素尿、管型尿、尿隐血（发生率 0.1%~5%），血肌酐升高（发生率 <0.1%）。
- 3) 肝脏损害：ALT（GPT）升高（发生率 ≥5%），AST（GOT）、ALT、r-GTP、LAP、LDH 和胆红素升高（发生率 0.1%~5%）。
- 4) 血液：嗜酸性粒细胞增多症、白细胞减少症、血小板减少症、贫血（发生率 0.1%~5%）。
- 5) 消化道反应：腹泻或软便、恶心、呕吐（发生率 0.1~5%），上腹不适、腹胀、黑便（发生率 <0.1%）。
- 6) 精神神经系统：头痛、头晕（发生率 0.1%~5%），短暂性意识障碍、短暂性精神障碍、精神异常（发生率 <0.1%）。
- 7) 其它：静脉炎（发生率 ≥5%），CK（CPK）升高、电解质紊乱（发生率 0.1%~5%），口干、舌炎（发生率 <0.1%）。

## 【禁忌】

对帕珠沙星及喹诺酮类药物有过敏史的患者禁用。

## 【注意事项】

- (1) 有支气管哮喘、皮疹、荨麻疹等过敏性疾病家族史的患者慎用。
- (2) 肾功能不全患者：严重肾功能不全患者血药浓度持续较高；本品使用前若用 0.9% 氯化钠注射液稀释，因氯化钠可解离出钠离子，可导致高血钠症。
- (3) 心脏或循环系统功能异常者慎用。本品使用前若用 0.9% 氯化钠注射液稀释，因氯化钠可解离出钠离子，易导致水钠潴留，从而使水肿症状加重。
- (4) 有抽搐或癫痫等中枢神经系统疾病的患者慎用。
- (5) 6-磷酸葡萄糖脱氢酶缺乏患者慎用。
- (6) 本品可导致休克，所以应用本品前要详察有无过敏性休克病史，以便在治疗期间准备必要的抢救药品和急救监护措施，以防止休克的发生。使用时如果出现过敏性休克，除急救外，尚需密切观察患者的神智、脸色、血压，保证患者的安全。

## 【孕妇及哺乳期妇女用药】

孕妇及有可能怀孕的妇女禁用；因药物可通过乳汁分泌，哺乳期妇女应用时应停止哺乳。

## 【儿童用药】

儿童用药的安全性尚未建立，建议儿童禁用本品。

## 【老年用药】

老年患者用药监测血药浓度、尿排泄量时， $C_{max}$ ，AUC 升高，尿中回收率下降，因此老年患者应用本品时应注意剂量。

## 【药物相互作用】

- (1) 本品可抑制茶碱在肝脏的代谢，使茶碱的血药浓度升高，可能发生茶碱中毒症状，如胃肠道反应、头痛、心率不齐、痉挛等，所以病人需要密切观察，两药合用时应密切观察茶碱的血药浓度。
- (2) 本品与苯基乙酸类、二乙酰酸类、非类固醇消炎镇痛剂合用时可能发生痉挛，所以应密切观察，如出现症状应立即停药并采取解痉治疗，当出现痉挛时，应终止两药的合用，保持呼吸道畅通，并使用抗痉挛的药物进行治疗。
- (3) 本品与华法林合用时，可增强华法林的作用，从而延长凝血时间，所以用药时应密切观察并做凝血时间试验。
- (4) 本品与丙磺舒合用时，血清半衰期延长，AUC 增加，但血药峰浓度无明显变化。

## 【药物过量】

不宜使用高于推荐剂量的治疗。如发生急性过量，应严密观察并给予对症和支持治疗。

## 【药理毒理】

### 药理作用

本品属喹诺酮类抗菌药，其主要作用机制为抑制金黄色球菌 DNA 旋转酶和 DNA 拓扑异构酶 IV 活性，阻碍 DNA 合成而导致细菌死亡；对人拓扑异构酶 II 的抑制作用弱。本品具有抗菌谱广、抗菌作用强的特点。对 G<sup>+</sup>菌如葡萄球菌、链球菌、肠球菌，对 G<sup>-</sup>菌如大肠杆菌、奇异变形杆菌、克雷伯菌、阴沟肠杆菌、柠檬酸杆菌、醋酸钙不动杆菌、流感嗜血杆菌、卡他莫杆菌、绿脓杆菌等均有良好的抗菌活性，本品对某些厌氧菌如产气荚膜梭状芽胞杆菌、核粒梭形杆菌、痤疮丙酸杆菌、吡啶单胞菌、部分消化链球菌、脆弱拟杆菌及普雷沃氏菌也有良好的抗菌活性。

### 毒理研究

重复给药毒性：大鼠静脉注射本品 4、13、39 和 130mg/kg/天，连续 3 个月后，130mg/kg 组大鼠 A/G（白蛋白/球蛋白）比值升高，少数大鼠可见关节软骨空洞形成，但猴静脉注射

本品 26、52 及 104mg/kg/天，连续 13 周后，未出现药物引起的异常反应。

**【药代动力学】**

据文献资料：健康志愿者单剂量静脉滴注甲磺酸帕珠沙星 300mg、500mg，静滴持续时间为 30 分钟，C<sub>max</sub> 分别为 8.99mg/L 与 11.0mg/L；AUC<sub>0-∞</sub>分别为 13.3mg h/L 及 21.7mg h/L；t<sub>1/2β</sub> 分别为 1.65 小时及 1.88 小时；T<sub>max</sub> 均为 0.5 小时。给药后本药可迅速分布至组织和体液中，静脉滴注本药 500mg 后，在痰液、肺组织、胆囊组织、烧伤皮肤组织及女性生殖器官组织的浓度分别为 2.49~6.24、7.95、9.85~35.5、4.54、5.00~13.9ug/g，在胆汁、胸水、腹水、脓液、盆腔液及脑脊液中的浓度分别为 5.47~29.9、1.43、1.87、4.73、3.18 及 0.33mg/L。50~500mg 单次静脉滴注 30 分钟，24 小时内尿排泄率为 90%，一次 300mg 一日二次给药，或一次 500mg 一日二次给药的尿排泄率与单次给药基本一致。药物经代谢后，胆汁和尿中的代谢物以葡萄糖醛酸化合物为主，其它代谢物浓度较低。肾功能障碍时，t<sub>1/2β</sub> 显著延长，AUC 显著升高，尿中排泄率显著下降。

**【贮藏】** 密闭保存。

**【包装】** 安瓿瓶装，2 支/盒；5 支/盒；10 支/盒。

**【有效期】** 暂定 24 个月。

**【执行标准】** 国家食品药品监督管理局标准 YBH14142006。

**【批准文号】** 国药准字 H20061054

**【生产企业】** 企业名称：江苏亚邦强生药业有限公司

生产地址：江苏省金坛市华城路 198 号

邮政编码：213200

电话号码：0519-82313008

传真号码：0519-82324949