



LOH-001
衛署衛製字第056750號

倍樂欣®

Bacflocin®
I.V. solution for infusion
5 mg/mL



1.【醫藥品名稱】

倍樂欣注射液 5毫克 / 毫升

2.【定性與定量組成】

包含100毫克Levofloxacin的20毫升小瓶。
包含500毫克Levofloxacin的100毫升小瓶。
光臨批發商清單請見第6.1節。

3.【藥物形式】

注射液
淡黃色至黃色澄清液。

4.【臨床特性】依文獻記載

4.1【治療適應症】

治療成人因對Levofloxacin有感受性的致病菌所引起之下列感染：
社區期肺炎
複雜性泌尿道感染（包括腎盂腎炎）
慢性細菌性前列腺炎
皮膚和軟組織感染
說明：國立Levofloxacin處方前，應考慮國家及 / 或當地適當使用Fluoroquinolones
抗生素之準則。

4.2【劑量與施用方法】

本藥須由醫師使用
Levofloxacin注射液每天經由靜脈緩慢注射一或兩次。劑量依據感染類型與嚴重性，
及防止致病病原的敏感性而定。通常可以依據患者狀況，在幾天內由一開始的
靜脈注射治療轉換為口服治療。由於非腸道與口服形式具有生物等效性，可以使
用相同的劑量。

治療持續時間

治療持續時間視病情而有差異。如同一般抗生素治療，患者復原或有證據顯示細
菌根除後，應持續施用Levofloxacin至少48到72小時。

施用方法

Levofloxacin注射液僅適用於緩慢靜脈注射：每日施用一或兩次。250毫克的注射
時間至少須至30分鐘，而500毫克Levofloxacin注射液至少為60分鐘（見第4.4節）。
依據患者狀況，可以在一開始施用靜脈注射幾天後，轉換為口服。不相容性請
見第6.2節，與其他注射液的相容性請見第6.6節。

劑量

建議施用下列劑量的Levofloxacin：			
腎功能正常患者的使用劑量（肌酐清除率>50 mL/min）			
適應症	劑量	頻率	每日給藥劑量（依據嚴重性）
社區期肺炎	250 mg/24 h	一次	500 mg/12 h
複雜性泌尿道感染（包括腎盂腎炎）	250 mg/24 h	一次	500 mg/12 h
慢性細菌性前列腺炎	250 mg/24 h	一次	500 mg/12 h
皮膚和軟組織感染	250 mg/24 h	一次	500 mg/12 h
嚴重感染病例應考慮增加劑量。			

特殊族群

腎功能受損（肌酐清除率≤50 mL/min）

給藥方式			
劑量	250 mg/24 h	500 mg/24 h	500 mg/12 h
肌酐清除率	首次劑量：250毫克	首次劑量：500毫克	首次劑量：500毫克
50-20 mL/min	之後：125 mg/24 h	之後：250 mg/24 h	之後：250 mg/12 h
10-10 mL/min	之後：125 mg/48 h	之後：125 mg/24 h	之後：125 mg/12 h
<10 mL/min (包含血液透析 及腹膜透析) 1	之後：125 mg/48 h	之後：125 mg/24 h	之後：125 mg/24 h

1 血液透析或腹膜透析(CAPD)後不須使用後續劑量。

肝功能受損

不須調整劑量，因為Levofloxacin並非由肝臟任何部位代謝，主要由腎臟排除。

年長患者

年長患者不須調整劑量，只需考量腎功能（見第4.4節QT間隔延長）。

兒童

Levofloxacin禁用於兒童及生長期青少年（見第4.3節）。

4.3【禁忌症】依文獻記載

- Levofloxacin注射劑不得用於：
 - 對Levofloxacin或任何其他Quinolone及任何形態過敏的患者，
 - 癲癇患者，
 - 患有施用Fluoroquinolone有關的肌腱病變史的患者，
 - 兒童或生長期青少年，
 - 懷孕期間，
 - 哺乳女性。

4.4【特別警告與使用注意事項】依文獻記載

對於肺炎球菌引起的嚴重感染，Levofloxacin可能不是最佳治療方式。

綠膿桿菌(P. aeruginosa)引起的院內感染可能需要合併治療。

注射時間

250毫克Levofloxacin注射劑的建議注射時間為至少30分鐘，而500毫克為至少60
分鐘。已知使用Levofloxacin時，注射期間可能會發生低血壓及暫時性血壓降低。
在罕見情況下，由於血壓大幅降低，可能發生循環性虛脫。如需懷疑注射
Levofloxacin (ofloxacin的R構物) 期間血壓降低，必須立即暫停注射。

梭狀芽孢桿菌(Clostridium difficile)引起的疾病

Levofloxacin注射劑治療期間或之後發生的下列，尤其是嚴重、持續及 / 或出血，
可能是梭狀芽孢桿菌引起的疾病症狀。最嚴重的症狀是偽膜性大腸炎(Pseudo-
membranous colitis)。如果懷疑發生偽膜性大腸炎，應立即停用Levofloxacin注射
劑，並立即針對患者進行支持性治療（如，口服萬古霉素）。在這種臨床情況下
禁用抑制腸蠕動的藥物。

肌腱炎及肌腱破裂

罕見情況下可能會發生肌腱炎。最常發生在Achilles tendon，並可能導致肌腱破
裂。在年長患者及使用皮質類固醇的患者身上，肌腱炎及肌腱破裂的風險會增加。
因此如果為這類患者開出Levofloxacin處方，應密切觀察。如果發生肌腱炎症狀
，所有患者均應諮詢醫師。如果懷疑發生肌腱炎，必須立即停止Levofloxacin治療
，並針對發病的肌腱，開始進行適當的治療。

容易發生癲癇的患者

Levofloxacin與鎮靜劑和其他Quinolone類藥物一樣，皆用於具有癲癇病史的患者。
且用於容易發生痙攣的患者時，應特別小心。例如具有中樞神經性的患者，
併用Fenbufen或類似的非甾體類抗炎藥物，或降低大腦興奮閾值的藥物，如茶
鹼的患者（見第4.5節）。抽痰作業時，應停用Levofloxacin治療。

敗血性感染或敗血性菌血症

患有敗血性感染或敗血性菌血症的急性感染患者，使用Quinolone抗細菌感
染藥物治療時，可能會發生溶血反應，因此使用Levofloxacin時應特別注意。

腎臟受損患者

由於Levofloxacin主要由腎臟排除，應調整腎臟受損患者的Levofloxacin劑量
（見第4.2節）。

過敏反應

Levofloxacin可能導致嚴重，甚至致命的過敏反應（如，導致過敏性休克的血管
性水腫），有時在初次給藥後就會發生（見第4.8節）。患者應立即停止治療，並
繼續觀察或急診室醫師。醫師會進行適當的緊急醫療處置。

血腫過低

如同所有Quinolone類藥物，會發生過血腫過低事件，通常在併用口服降血糖藥
物（如Glibenclamide）或與易出血的藥物患者身上發生。用於這些糖尿病
患者時，建議小劑量口服。 （見第4.8節）。

預防的光過敏反應

雖然Levofloxacin引發的光過敏反應很罕見，建議患者應盡量不要接觸強烈日光
或人工紫外光（如，日光燈或日光浴），以避免發生光過敏反應。

使用維他命K拮抗劑或抗凝劑的患者
由於使用Levofloxacin治療的患者併用維他命K拮抗劑（如Warfarin）時，可能
會增加凝血功能參數(PT/INR)及 / 或出血，同時施用這些藥物時，應進行凝血檢
測（見第4.5節）。

精神病反應

服用Quinolone類藥物的患者會發生過精神病反應，包含Levofloxacin。在極罕見
情況下，這些精神病反應會發展出自殺念頭及自殘行為。有時候僅施用一劑
Levofloxacin就會發生（見第4.8節）。患者發展出這些反應時，應停用Levofloxacin
並採取適當的措施。如果要將Levofloxacin用於精神病患，或具有精神病史的患
者，應特別注意。

QT間隔延長

將包含Levofloxacin在內的Fluoroquinolones用於已知有QT間隔延長風險因子的
患者時，應特別注意。這些風險因子包含：

- 先天性或QT症候群
- 併用已知可能延長QT間隔的藥物（如，類別IIa與III抗心律不整藥物，三環抗憂鬱藥
物，巨環素等）。
- 電解質失衡尚未回覆（如，血鉀過低症，血鎂過低症）
- 年長患者
- 心臟疾病（如心臟衰竭，心肌梗塞，心跳過慢）（見第4.2節年長，第4.5節，第
4.8節，第4.9節）。

周邊神經病變

服用Fluoroquinolones（包含Levofloxacin）的患者曾發生過感覺或感覺運動性週
神經病變，其發作可能非常迅速。如果患者發生神經病變症狀，應停用Levofloxacin
，以避免發展出不可逆病症。

膽片類固醇藥物

使用Levofloxacin治療的患者，尿還原片類固醇檢測可能會出現陽性結果，可
能需要採用專一性更高的方法，確認陽性藥物篩檢結果。

肝膽管疾病

使用Levofloxacin曾發生過肝膽管炎案例，甚至產生危及生命的肝衰竭，這些案例
主要發生在患有潛在嚴重疾病的患者身上，如敗血症（見第4.8節）。如果發展出肝
臟疾病徵兆與症狀，如食欲不振、黃疸、尿液混濁、腹部脹氣或易痛等，應建議患
者停止治療並聯繫其醫師。

4.5【與其他醫藥產品的交互作用，及其他形式的交互作用】依文獻記載

其他醫藥產品對於Levofloxacin的影響
Theophylline、Fenbufen或類似的非皮質類固醇發炎藥物
臨床研究中沒有發現到Levofloxacin與Theophylline會產生藥物動力學交互作用，
不過Quinolones與Theophylline、非皮質類固醇發炎藥物、或降低興奮閾值的藥物
同時施用時，可能會導致大腦興奮閾值大幅降低。在Fenbufen存在的情況下，
Levofloxacin的藥效大約比單獨施用時高13%。

Probenecid與Cimetidine

Probenecid與Cimetidine在統計上會顯著影響Levofloxacin的排除。Cimetidine與
Probenecid分別會降低Levofloxacin的腎臟排除率24%與34%。這是因為這兩種藥
物都抑制Levofloxacin透過腎管分泌。不過，使用研究測試過的劑量時，統計上
有關聯的動力學差異，但不至可能產生臨床上的重要影響。同時施用Levofloxacin
及影響腎管分泌的藥物，如Probenecid與Cimetidine時，應特別注意，尤其是在用腎
臟受損的患者身上時。

其他重要資訊

臨床藥理學研究已經顯示，Levofloxacin與下列藥物同時施用時，其藥物動力學不會
受到臨床上的重要影響：碳酸鈣、毛地黃、Glibenclamide、Ranitidine。

Ciclosporin

Ciclosporin與Levofloxacin同時施用時，半衰期會增加33%。

維他命K拮抗劑

併用Levofloxacin與維他命K拮抗劑（如Warfarin）的患者，曾發生凝血功能參數
(PT/INR)及 / 或出血增加的情況，這些情況可能很嚴重。因此，應密切監測使用維
他命K拮抗劑治療患者的凝血參數（見第4.4節）。

已知延長QT間隔的藥物

Levofloxacin和其他Fluoroquinolones一樣，用於服用已知延長QT間隔藥物的患
者時，應特別小心（如，類別IIa及III抗心律不整藥物、三環抗憂鬱劑、巨環素藥）。
（見第4.4節QT間隔延長）。

4.6【懷孕與哺乳】依文獻記載

懷孕

動物生殖研究沒有發生具體的問題。不過在缺乏人類資料，且Fluoroquinolones具
有破壞成長生物承重軟骨的可能實驗風險的情況下，Levofloxacin不應用於懷孕女
性（見第4.3與5.3節）。

哺乳

在缺乏人類資料，且Fluoroquinolones具有破壞成長生物承重軟骨的可能實驗風險
的情況下，Levofloxacin不應用於哺乳女性（見第4.3與5.3節）。

4.7【對於開車與操作機器能力的影響】依文獻記載

某些不良影響（如眩暈、嗜睡、視覺模糊）可能影響患者的集中力與反應能力，因
此在服用藥物期間應避免駕駛車輛，可能會造成風險（如，開車或操作機器）。

4.8【副作用】依文獻記載

下列資訊來自超過5000位患者參與的臨床研究，及上市後的廣泛用藥經驗。不良反
應依據下表中的MedRA系統層級詳細描述。表中列出的頻率定義如下：很常見
(≥1/10)，常見(≥1/100，<1/10)，不常見(≥1/1000，≤1/100)，罕見(≥1/10000，
≤1/1000)，超罕見(≤1/10000)，未知（無法從獲據資料推估）。在每個頻率分群
中，不良反應依據嚴重性的嚴重性排序。

a. 傳染與感染

不常見：真菌感染（及其他具抗藥性微生物增生）

b. 血液與淋巴系統疾病

不常見：白血球減少，嗜中性白血球增加(Eosinophilia)

罕見：血小板減少，中性白血球減少

很罕見：粒性白血球減少症

未知：各類白血球細胞減少，溶血性貧血

c. 免疫系統疾病

很罕見：過敏性休克（見第4.4節）

過敏性與過敏性反應有時可能在前一劑後就發生

未知：過敏（見第4.4節）

d. 代謝與營養疾病

不常見：食慾不振

很罕見：血酸過低，尤其是糖尿病患者（見第4.4節）

e. 精神疾病

不常見：失眠，神經質

罕見：精神疾病，憂鬱，意識混濁，易怒易怒，焦慮

很罕見：具有自行為的精神病反應，包含自殺念頭或行為（見第4.4節），幻覺

f. 神經系統疾病

不常見：麻痺，頭痛，頭暈

罕見：顫抖，感覺異常

很罕見：感覺運動覺醒周邊神經病變，包含喪失味覺在內的味覺障礙，包含喪
失嗅覺在內的嗅覺障礙。

g. 眼

很罕見：視覺模糊

h. 耳與迷路疾病

不常見：暈眩

很罕見：聽力受損

i. 心臟疾病

罕見：心跳過快

未知：心跳過慢

罕見：心跳過慢

罕見：心跳過慢

j. 中樞神經

常見：解離症

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

罕見：低血鈣

4.9【劑量過量】依文獻記載
依據超過治療劑量的動物研究或臨床藥理學研究，最重要的Levofloxacin注射液急性毒性試驗結果為中樞神經系統症狀，例如精神混亂、暈眩、意識模糊、及抽搐性痙攣、QT間隔增加。
劑量過量時，應針對症狀進行治療，應進行心電圖監測，因為可能發生QT間隔延長。血液透析，包括經動透析與CAPD，不足以將Levofloxacin從身體排除。目前沒有有效的解毒劑。

5.【藥性性質】依文獻記載

5.1【藥物藥效學性質】依文獻記載
藥物治療分類：Quinolones類抗細菌感染藥物，Fluoroquinolones
ATC代碼：J01MA12
Levofloxacin是一類合成Fluoroquinolones類抗細菌感染藥物，是左旋旋合藥物Ofloxacin的(S)-映映異構體。
作用機制
作為一種Fluoroquinolones類抗細菌感染藥物，Levofloxacin作用在DNA-DNA-旋轉酶(gyrase)複合體與第四型拓撲其構酶(Topoisomerase IV.)。
PK/PD關連性
Levofloxacin的殺菌活性，與血中最大濃度(Cmax)或曲線下面積(AUC)和最低抑制濃度(MIC)之間的比例有關。
抗藥性產生機制
主要抗藥性機制來自一個gyr-A基因突變。在體外研究中，Levofloxacin與其他Fluoroquinolones之間有交叉抗藥性。
基於其作用機制，Levofloxacin與其他類別的抗細菌感染藥物之間，通常沒有交叉抗藥性。

用藥臨界點
EUCAST將Levofloxacin易感與中度易感菌種分開，中度易感與抗藥性菌種分開，其建議之MIC用藥臨界點列在下面的MIC檢測(mg/L)表中。
EUCAST的Levofloxacin用藥臨界點MIC臨界點(2006-06-20)：

病原	易感性	抗藥性
肺炎菌(Enterobacteriaceae)	≤1 mg/L	>2 mg/L
假單胞菌屬(Pseudomonas spp.)	≤1 mg/L	>2 mg/L
不動桿菌屬(Acinetobacter spp.)	≤1 mg/L	>2 mg/L
葡萄球菌屬(Staphylococcus spp.)	≤1 mg/L	>2 mg/L
肺炎鏈球菌(S. pneumoniae) ¹	≤2 mg/L	>2 mg/L
A, B, C, G型鏈球菌	≤1 mg/L	>2 mg/L
感冒嗜血桿菌(H. influenzae)	≤1 mg/L	>1 mg/L
黏膜炎莫氏菌(M. catarrhalis) ²	≤1 mg/L	>1 mg/L
與藥性無關之用藥臨界點 ³	≤1 mg/L	>2 mg/L

1 S/I用藥臨界點從1.0增加到2.0，以避免將野生種MIC分布分開。該用藥臨界點與高劑量治療有關。
2 MIC數值超過S/I用藥臨界點的菌株很少見或尚未見諸報告。這些菌種的辨識與抗微生物藥物易感性檢測，必須再度進行，如果確認結果，菌種必須進行參考實驗室。
3 與菌種無關之用藥臨界點，主要依據藥物動力學/藥物效力學資料決定，與具體菌種的MIC分布無關。這些僅用於還沒有提供菌種專用藥臨界點的菌種，而非用於易感性檢測顯示不建議使用，或證據不足以證實該菌種為良好菌種（鏈球菌、奈瑟氏菌屬，革蘭氏陰性厭氣菌）。

CLSI：臨床實驗室標準化機構，前身為NCCLS）將Levofloxacin易感與中度易感菌種分開，中度易感與抗藥性菌種分開，其建議之MIC用藥臨界點列在下面的MIC檢測(μg/mL)或培養血擴散檢測（使用5μg Levofloxacin培養皿的區域直徑[mm.]）表中。
CLSI建議的Levofloxacin MIC與培養皿擴散菌種(M100-S17, 2007)：

病原	易感性	抗藥性
肺炎菌(Enterobacteriaceae)	≤2 μg/mL ≤17 mm	≥8 μg/mL ≤13 mm
非腸桿菌(Non Enterobacteriaceae)	≤2 μg/mL ≤17 mm	≥8 μg/mL ≤13 mm
不動桿菌屬(Acinetobacter spp.)	≤2 μg/mL ≤17 mm	≥8 μg/mL ≤13 mm
Stenotrophomonas maltophilia	≤2 μg/mL ≤17 mm	≥8 μg/mL ≤13 mm
葡萄球菌屬(Staphylococcus spp.)	≤2 μg/mL ≤17 mm	≥8 μg/mL ≤13 mm
肺炎菌屬(Enterococcus spp.)	≤2 μg/mL ≤17 mm	≥8 μg/mL ≤13 mm
感冒嗜血桿菌(H. influenzae)	≤2 μg/mL ≤17 mm	≥8 μg/mL ≤13 mm
黏膜炎莫氏菌(M. catarrhalis) ¹	≤2 μg/mL ≤17 mm	≥8 μg/mL ≤13 mm
肺炎鏈球菌	≤2 μg/mL ≤17 mm	≥8 μg/mL ≤13 mm
Beta溶血性	≤2 μg/mL ≤17 mm	≥8 μg/mL ≤13 mm
鏈球菌	≤2 μg/mL ≤17 mm	≥8 μg/mL ≤13 mm

1 若抗藥性菌株不存在或罕見，則首先排除（易感性）以外的所有結果類別。若菌種出現結果顯示屬於（非易感性）類別，應由參考實驗室使用CLSI參照表格方法確認菌種辨識與抗微生物藥物易感性檢測結果。

抗菌劑
特定藥不可定期時間的抗藥性發生率可能有差異，最好能取得當地抗藥性資訊，尤其是治療嚴重感染的時候。在當地抗藥性發生率達到將藥物用於至少某些類型感染的效果存疑時，應視需要尋求專家建議。
常見易感性菌種
好氧革蘭氏陽性菌
甲氧基青黴素(Methicillin)有效之金黃色葡萄球菌*
肺炎性葡萄球菌(Staphylococcus saprophyticus)
C型及G型鏈球菌
肺炎鏈球菌(Streptococcus agalactiae)
肺炎鏈球菌*
化膿性鏈球菌(Streptococcus pyogenes)*
好氧性革蘭氏陰性菌
Burkholderia cepacia \$
黏菌艾肯氏菌(Eikenella corrodens)
感冒嗜血桿菌(Haemophilus influenzae)*
副流感嗜血桿菌(Haemophilus para-influenzae)*
產克雷白氏菌(Klebsiella oxytoca)
肺炎克雷白氏菌(Klebsiella pneumoniae)*
Moraxella catarrhalis。
巴斯德氏菌(Pasteurella multocida)
普魯變形桿菌(Proteus vulgaris)
Providencia rettgeri
厭氣菌
消化鏈球菌屬(Peptostreptococcus)

其 他
肺炎披衣菌(Chlamydia pneumoniae)*
肺炎熱脈衣菌(Chlamydia psittaci)
沙眼衣菌(Chlamydia trachomatis)
肺炎退伍軍人桿菌(Legionella pneumophila)*
肺炎支原體屬(Mycoplasma pneumoniae)*
人型支原體(Mycoplasma hominis)
附著性支原體(Ureaplasma urealyticum)
獲得抗藥性後可能造成問題的菌種
好氧革蘭氏陽性菌
糞腸球菌(Enterococcus faecalis)*
具甲氧基青黴素抗藥性之金黃色葡萄球菌
滅血跡陰性之葡萄球菌屬
好氧性革蘭氏陰性菌
黏氏不動桿菌(Acinetobacter baumannii)*
弗氏桿桿菌(Citrobacter freundii)*
產氣桿菌(Enterobacter aerogenes)
Enterobacter agglomerans
陰溝桿菌(Enterobacter cloacae)*
大腸桿菌(Escherichia coli)*
Morganella morganii*
奇異變形桿菌(Proteus mirabilis)*
Providencia stuartii
綠膿桿菌(Pseudomonas aeruginosa)*
沙雷氏黏質菌(Serratia marcescens)*

厭 氣 菌
梭狀芽菌(Bacteroides fragilis)
類形類桿菌(Bacteroides ovatus) \$
多形類桿菌(Bacteroides thetaiotamicron) \$
普普通桿菌(Bacteroides vulgatus) \$
芽孢桿菌(Clostridium difficile) \$
* 經過實在核可臨床適應症中，對易感性菌種有臨床藥效。
\$ 天然的中度易感性

其他資訊
綠膿桿菌(P. aeruginosa)引起的院內感染可能需要合併治療。
5.2【藥物動力學性質】依文獻記載
吸 收
口服服用Levofloxacin會迅速並幾乎完全吸收，1小時內達到最高血中濃度。對生體可用率幾乎為100%。
食物對Levofloxacin吸收的影響很小。
分 佈
大約30-40%的Levofloxacin與血中蛋白質結合。每日一次500毫克Levofloxacin多次給藥後，藥量累積可以忽略不計。每日兩次500毫克給藥後，Levofloxacin出現中度但可預測的藥量累積情形。3天內會達到穩定狀態。
穿透進入組織與體液：
穿透進入支氣管黏膜，上皮內襯液體(Epithelial Lining Fluid, ELF)
支氣管黏膜與上皮內襯液體透過
口服500毫克後的最大Levofloxacin濃度分別為8.3 μg/g與10.8 μg/mL。這些大約會在施用後一小時達到。
穿透進入肺組織
口服500毫克Levofloxacin後，肺組織的最大Levofloxacin濃度大約為11.3 μg/g，在施用後4到6小時之間達到。肺部濃度持續超過血中濃度。
穿透進入氣泡液體
每日給藥一次或兩次500毫克，給藥三天，施用後2-4小時，水泡液體中的最大Levofloxacin濃度大約分別為4.0與6.7 μg/mL。
穿透進入腦脊液體
Levofloxacin穿透到腦脊液體的能力很差。
穿透進入前列腺組織
每日口服施用一次500毫克Levofloxacin三天後，施用2小時，6小時，及24小時後，前列腺組織的平均濃度為8.7 μg/g，8.2 μg/g與2.0 μg/g；平均前列腺/血中濃度比為1.84。
尿液中的濃度
每次口服施用150毫克，300毫克或500毫克Levofloxacin 8-12小時後，平均尿液中濃度分別為44 mg/L，91 mg/L與200 mg/L。
生物轉換
Levofloxacin被代謝的比例很低，代謝物為Desmethyl-Levofloxacin與Levofloxacin-N-oxide。這些代謝物佔尿液排出劑量的5%以下。Levofloxacin的立體化學性質穩定，不會進行鏡像異構物轉換。

排 除
口服與靜脈施用Levofloxacin後，會以相對較慢的速率從血中排出（t1/2：6-8小時）。主要經由腎臟排泄（≥85%的劑量）。
靜脈注射與口服施用Levofloxacin後，藥物動力學沒有重大差異，顯示口服與靜脈注射給藥方式可以互換。
藥 性
1 Levofloxacin在50到600毫克劑量範圍內，遵循線性藥物動力學。
腎功能不足患者
Levofloxacin的藥物動力學可能會受到腎功能不足的影響。腎功能下降時，腎臟的排出與清除率會下降，而排除半衰期如下表所示增加。

C _{1p} (mL/min)	13	26	50-80
t _{1/2} (小時)	35	27	9

年經患者
年輕與年長受試者的Levofloxacin藥物動力學沒有顯著差異，與肌酐清除率有關的參數除外。
性別差異
男性與女性受試者的獨立分析顯示，Levofloxacin藥物動力學有很小到最低限度的性別差異。沒有證據顯示這些性別差異在臨床上有何重要性。
5.3【臨床前安全性資料】依文獻記載
急性毒性
小鼠與大鼠靜脈注射施用Levofloxacin的中位致死劑量(LD50)數值位於250-400 mg/kg；狗的LD50數值大約為200 mg/kg，接受這個劑量的動物有一半會死亡。
重複給藥毒性
在大鼠(D0, 60, 180 mg/kg/day)與猴子(10, 25, 63 mg/kg/day)進行過靜脈注射施用一個月研究，而大鼠進行過三個月研究(10, 30, 90 mg/kg/day)。大鼠研究中，一個月與三個月沒有觀察到不良事件的濃度(NOEL)分別為20與30 mg/kg/day。兩組研究在劑量20 mg/kg/day及更高時，尿液中都會觀察到結晶狀殘留物。高劑量（一個月研究中180 mg/kg/day或三個月研究中30 mg/kg/day及更高）會略略降低食物消耗量與體重。血液檢查顯示一個月結束時，紅血球減少而白血球及網狀紅血球增加，但三個月研究沒有變化。猴子研究中的NOEL為63 mg/kg/day，這個劑量時，只會略略降低食物與飲水消耗量。
生殖與發育性
口服劑量高達360 mg/kg/day，或靜脈注射劑量高達100 mg/kg/day的Levofloxacin，不會致大鼠的生育力或生殖能力受到影響。
口服劑量高達10 mg/kg/day，或靜脈注射劑量達60 mg/kg/day，不會對大鼠造成致畸胎影響。兔子口服劑量50 mg/kg/day或靜脈注射劑量達25 mg/kg/day時，沒有觀察到致畸胎性質。Levofloxacin對生育力沒有影響，而對於胚胎的唯一影響是生長遲緩，這是母體毒性造成的結果。
基因毒性
Levofloxacin不會對細菌或哺乳類細胞造成基因毒性，但是在100 μg/mL或更高濃度時，會在沒有經過代謝活化的情形下，誘發體外的中國倉鼠肺細胞(CHL)產生染色體異常。體內試驗（體核、姐妹染色體交換，未精定DNA合成，顯性致死試驗）沒有發現任何致基因毒性能力。

光毒性能力
小鼠靜脈注射及口服研究顯示，Levofloxacin只會在高劑量具有光毒性活性。Levofloxacin在光致突變檢測中，沒有觀察到任何基因毒性，且在光致腐蝕性檢測中，沒有觀察到腐蝕性。
致畸可能性
老鼠飲食施用兩年的研究中，沒有發現任何致畸可能性(0, 10, 30 and 100 mg/kg/day)。
對關節的毒性
如同其他Fluoroquinolones類，Levofloxacin對於大鼠與狗的軟骨有影響（出現風泡與空洞）。這些結果在幼動物中較明顯。
6.【藥物細目】
6.1【服用劑量】
氯化鈉鹽
鹽酸鹽(pH 4.8)
注射用水
6.2【不相容性】
Levofloxacin 5 mg/mL注射液不應與肝素或鹼性溶液混合（如碳酸氫鈉）。除了第6.6節所列產品外，本藥品不得與其他藥品混合。
6.3【保存期限】
除非外包裝後有保存期限：3天（室內限下）。
橡膠塞子穿孔後保存期限：立即使用（見第6.6節）。
從微生物學觀點來看，注射液應立即使用。如果沒有立即使用，使用中儲存時間與條件將使用者應承擔之責任。
6.4【儲存特殊注意事項】
將瓶子放在外盒中，以防光照射（見第6.3節）。使用前先檢查外觀。只應使用不含顆粒的清涼溶液。25℃以下儲存。
6.5【包 裝】
90毫升，100毫升小瓶，100支以下盒裝。
6.6【重要特殊注意事項】
Levofloxacin注射液應在橡膠塞子穿孔後立即使用（3小時內），以避免任何細菌污染。
注射時不須避光照射。
如同所有藥物，任何未使用的藥品應依據符合當地環保法規棄置。
與其他注射液混合使用
Levofloxacin注射液與下列注射液相容：
0.9%氯化鈉溶液USP。
5%葡萄糖注射液USP。
含2.5%葡萄糖的林格氏液。
不相容性請參見第6.2節。



永信藥品工業股份有限公司

YUNG SHIN PHARMACEUTICAL IND. CO., LTD.

公司 地 址：台中市大甲區中山路一段1191號

電 話：(04) 2 6 8 7 5 1 0 0

台中幼獅廠：台中市大甲區白蘭里工九路27號