

樂作欣 膜衣錠100毫克
Rozoxin F.C. Tablets 100mg

衛署藥製字第 G-8458 號
046634 號

Rozoxin錠是Quinolone類廣效口服抗菌劑。含有levofloxacin，即：消旋體Ofloxacin，之一的光學活性(一)-s體。本劑不僅對葡萄球菌屬、肺炎球菌、化膿鏈球菌、溶血鏈球菌及腸球菌屬等革蘭氏陽性菌及大腸桿菌、克雷白氏桿菌屬、變形桿菌屬、綠膿桿菌屬等流行性感冒嗜血菌等革蘭氏陰性菌具有廣泛而強力的抗菌力，對厭氧菌(Peptostreptococcus SP.)及砂眼披衣菌亦顯示抗菌力。本劑服用後，迅速在各組織達最高濃度，而無蓄積作用，大部分由尿中以原形排泄。臨床上，使用在呼吸器官感染症，泌尿生殖器官感染症，膽道感染症，腸道感染症及外科、婦產科、皮膚科、耳鼻喉科、眼科、齒科、口腔外科等領域的各種感染症之治療，顯示具有優良的效果。

組成
Rozoxin錠為1錠中含有levofloxacin 100mg之白色~微黃白色的錠劑。

適應症

有感受性細菌引起之呼吸道感染症、耳鼻喉科感染症、泌尿道感染症、子宮內感染、子宮頸管炎、子宮附屬器炎、細菌性赤痢、腸炎、巴多林氏腺炎、輕度及中度皮膚軟組織表淺性感染。

說明

由葡萄球菌屬、肺炎球菌、化膿鏈球菌、溶血鏈球菌、腸球菌屬、Peptostreptococcus屬、淋菌、Branhamella catarrhalis (卡他布蘭漢氏球菌)、Propionibacterium acnes、大腸桿菌、枸橼桿菌屬、沙門桿菌屬(傷寒菌、副傷寒菌除外)、志賀氏桿菌屬、克雷白氏桿菌屬、腸內桿菌屬、沙雷氏菌屬、變形桿菌屬、霍亂弧菌、綠膿桿菌屬、流行性感冒嗜血菌、Acinetobacter屬、Campylobacter屬、砂眼披衣菌之中對本劑具感受性的細菌所引起的下列感染症：

- ◎ 肺炎、慢性支氣管炎、瀰漫性泛支氣管炎、支氣管擴張症(感染時)、慢性呼吸道疾病的二次感染。
- ◎ 咽喉頭炎、扁桃腺炎(扁桃周圍膿炎、扁桃周圍膿瘍)、急性支氣管炎。
- ◎ 腎盂腎炎、膀胱炎、前列腺炎、副睪丸炎、淋菌性尿道炎、非淋菌性尿道炎。
- ◎ 子宮內感染、子宮頸管炎、子宮附屬器炎、巴多林氏腺炎。
- ◎ 毛囊炎(含膿包性痤瘡)、癰、癰腫症、癰、傳染性膿痂疹、丹毒、蜂蟻性皮炎、淋巴管(結)炎、化膿性甲溝炎(瘡疽)、皮下膿瘍、汗腺炎、集簇性痤瘡、感染性粉瘤、肛門周圍膿瘍。
- ◎ 乳腺炎、外傷、燙傷、手術創傷等之表淺性二次感染症。
- ◎ 膽囊炎、膽管炎。
- ◎ 外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎、化膿性唾液腺炎。
- ◎ 眼腺炎、麥粒腫、淚囊炎、結膜炎、睑板腺炎。
- ◎ 細菌性赤痢、感染性腸炎、沙門桿菌腸炎、霍亂。
- ◎ 牙周組織炎、牙周周圍炎、顎炎。

用法・用量

本藥須由醫師處方使用：

通常成人1次100mg levofloxacin，(即Rozoxin 1錠)，1天口服2~3次，可依感染症的種類及症狀適宜增減用量，但對重症或效果不足的病例，1次200mg levofloxacin，(即Rozoxin 2錠)，1天口服3次。

使用上注意事項

下列事項請注意。

使用本劑的患者，為防止抗藥性的發生，原則上在確認對致病菌的敏感度後，對疾病的治療應以最短的期間服用。

警語：
本藥品具有使重症肌無力惡化之風險，具有重症肌無力患者應避免使用。

觀察到使用levofloxacin兒童患者，比起未使用者更易發生肌肉骨骼疾病(關節痛，關節炎，肌腱和步態異常)之不良反應。動物實驗中在未成年的大鼠和幼犬，給予口服和靜脈注射之levofloxacin皆會導致骨軟骨病(osteochondrosis)增加，且於幼犬組織病理學檢查顯示，其承受重量的關節(weight-bearing joint)軟骨持續病變。其他氟喹諾酮類藥物亦會造成未成年動物承受重量的關節軟骨病變及關節痛等不良反應。

1. 禁忌（下列患者請勿服用）
 - 1) 曾對本劑成分及Ofloxacin有過敏症的患者。
 - 2) 孕婦或可能懷孕的婦人。（參照「孕婦-授乳婦的服用」之項）
2. 謹慎使用（下列患者請謹慎服用）
 - 1) 嚴重的腎臟障礙患者（會持續的保持高血中濃度）。
 - 2) 罹患或曾患過癲癇等痙攣性疾病患者。（可能引起痙攣）。
 - 3) 曾對Quinolone系抗菌劑有過敏的患者。
 - 4) 高齡者（參考「高齡者的服用」之項）。
3. 相互作用
合併使用時注意事項
 - 1) 與Phenyl acetate系或Propionate系非類固醇性消炎鎮痛劑併用時（可能發生痙攣）。
 - 2) 與含有鋅或鎂之制酸劑、鐵劑併用時(本劑的吸收下降、效果減弱)。
4. 副作用（「罕有」：0.1%以下，「偶有」：0.1~5%，「無註明者」：5%以上或頻率不明）
 - 1) 重大副作用
下列重大副作用罕有發生，須充分觀察，發現異常時，請中止服用，並做適當的處理。

- (1) 休克、過敏性反應
(初期症狀：紅斑、惡寒、呼吸困難等)
 - (2) 中毒性表皮壞死症(Lyell症候群)
皮膚黏膜疹症群(Stevens-Johnson症候群)
 - (3) 痙攣
 - (4) 急性腎不全
 - (5) 黃疸
(初期症狀：想吐、嘔吐、食慾不振、倦怠感、搔癢等)
 - (6) 無顆粒球症 (初期症狀：發熱、咽喉痛、倦怠感等)
 - (7) 間質性肺炎
(症狀：發熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X光線檢查異常、嗜酸性球增多等)
(處置方法：投與副腎皮質荷爾蒙劑等)
 - (8) 偽膜性大腸炎等伴有血便之重症大腸炎
(症狀：腹痛、頻頻下痢)
 - (9) 橫紋肌溶解症(急性腎機能障礙所引起)
(症狀：肌肉痛、無力感、CPK上昇、血中及尿中肌球蛋白質上昇等)
 - (10) 低血糖(糖尿病患者、有腎臟功能障礙者易發生)
 - (11) 跟腱炎、腱斷裂等的腱障礙
 - (12) 錯亂等的精神症狀
- 2) 在國外的重大副作用
下列重大副作用在海外，於其他New quinolone抗菌劑也有罕見發生的報告要充分注意，發生異常時，請中止服用，並做適當處理。
 - (1) 溶血性貧血。
 - (2) 過敏性血管炎。
 - (3) 抑鬱。
 - 3) 其他副作用
 - (1) 過敏症 罕有浮腫、蕁麻疹、熱感、光線過敏症，又偶有發疹搔癢等發生，此症狀發生時，請中止服用。
 - (2) 精神神經系 罕有戰慄、麻木感、視覺異常，耳鳴、幻覺、睡意，又偶有睡不著、頭暈、頭痛等症狀發生。
 - (3) 腎臟 偶有BUN、Creatinine上昇的現象。
 - (4) 肝臟 偶有GOT、GPT、Al-P、T-GTP 上昇的現象。
 - (5) 血液 偶有貧血、白血球減少、血小板減少、嗜酸性球增多等現象發生，異常時，請中止服用。
 - (6) 消化器 偶有噁心、嘔吐、腹部不快感、下痢、食慾不振、腹痛、消化不良，罕有口內炎、舌炎、口渴、腹部膨脹感、便秘等現象發生。
 - (7) 其他 罕有倦怠感、發燒、關節痛、悸動、味覺異常等現象發生。
5. 高齡者的服用
本劑主要由腎臟排泄(參照「體內藥物動態」)，高齡者大都腎臟機能下降，唯恐發生持續性血中高濃度，請注意1次100mg、1天2次等投與量及投與間隔，謹慎服用。
6. 孕婦、授乳婦的服用
 - 1) 對懷孕中的婦女，安全性上未確立，孕婦或可能懷孕的婦女，請勿服用。
 - 2) 已知Ofloxacin等會移轉到母乳中，授乳婦請避免服用，不得已非服用時，請避免授乳。
7. 使用上的注意
交付藥劑時，對於PTP包裝的藥劑應指導患者自PTP片取出藥品後服用(曾有報告稱，因誤服PTP片後，硬的銳角刺入食道黏膜，進而引起穿孔，併發縱膈氣囊等嚴重的併發症)。
8. 其他
動物實驗(幼犬、幼成犬(13個月齡)，小白鼠)有關節異常的現象發生。

藥效藥理

抗菌作用

Levofloxacin對包括厭氧菌的革蘭氏陽性菌群及革蘭氏陰性菌群具有廣效性的抗菌作用。對葡萄球菌屬、肺炎球菌、化膿鏈球菌、溶血鏈球菌、腸球菌屬及包含大腸桿菌、克雷白氏桿菌、沙雷氏菌屬、變形桿菌屬的腸內細菌群，葡萄糖非發酵革蘭氏陰性菌群，流行性感冒嗜血桿菌，淋菌等顯示具有強力的抗菌活性，又對披衣菌亦具有抗菌力。於實驗的小白鼠感染防禦試驗及感染治療試驗，levofloxacin顯示具有優異的預防及治療效果。

作用機轉

Levofloxacin的主要作用機轉為阻礙DNA Gyrase活性，其強度為Ofloxacin的2倍。MIC與MBC之間無大的差異，是殺菌性的抗菌劑。此外，對細菌形態學觀察中，於MIC附近濃度下出現溶菌現象。

體內藥物動態

血中濃度

對健康成人口服投與單劑量時，血中濃度與服用量有相關變動。Levofloxacin 100mg，飯後口服，經過0.9~2.4小時達最高濃度，其濃度為1.2μg/ml。生物學的一半衰期為4.0小時。於空腹時口服投與100mg，經過0.8小時即達到最高血中濃度，其濃度為1.4μg/ml。

分佈

健康成人或患者，一次口服levofloxacin 100mg或200mg時，此藥運送至下列組織的濃度很高，皮膚(於0.8~4小時，對血清濃度比：平均1.1)，唾液(對血清濃度比：約0.7)，口蓋扁桃(對血清濃度比:約2)，唾液(對血清濃度比：0.8~1.1)，前列腺(投與後1~6小時，對血清濃度比：0.8~1.9)，前列腺液(投與後1.5小時，對血清濃度比：約0.6)，膽囊(對血清濃度以：0.3~4.2)，房水(投與後2~9小時，對血清濃度比0.14~0.31)，淚液(投與100mg時，最高平均濃度0.61μg/ml)，耳漏(投與後2小時，對血清濃度比：0.6)，上顎竇黏膜(投與後2~6小時，對血清濃度比：1.1~1.9)，女性生殖器(投與100mg時，經過3~4小

時後，0.6~2.1μg/ml）。等顯示有很高的移動性

代謝・排泄

健康成人單劑量口服時，尿中濃度與服用量的相關變動如下：
Levofloxacin 100mg飯後服用，尿中濃度在服用後0~2小時達到最高的236μg/ml，即使於服用後12~24小時，也仍然維持31μg/ml，在體內幾乎不代謝，服用後48小時，在尿中，服用量之約85%以原形排泄之。又，一次口服Levofloxacin 100mg時，服用後48小時之累積尿中排泄藥，腎機能輕度障礙者（70>Ccr≥40）為66.6%，中度障礙者（40> Ccr≥20）為55.7%，嚴重程度障礙者（Ccr< 20）為22.0%，即腎機能下降者，會引起尿中排泄率下降。

臨床適用

臨床效果

日本國內以各種感染症為對象，實施一般臨床試驗的概要如下：

呼吸道感染症

對由葡萄球菌屬、肺炎球菌、Branhamella catarrhalis、肺炎桿菌、綠膿桿菌、流行性感冒嗜血菌等引起的呼吸道感染症459例，有效率为85.0%（390例），對被稱為難治性的支氣管擴張症（感染時）79例，有效率为68.4%（54例），對潮濕性泛支氣管炎26例的有效率为84.6%（22例）。至於其他疾患，所得到的臨床效果為，對肺炎70例的有效率为91.4%（64例），對慢性呼吸道疾患的二次感染58例，有效率为84.5%（49例）。又，以慢性下呼吸道感染症及肺炎為對象，作雙重比較試驗，已被認為有效。

尿路感染症

對由葡萄球菌屬、腸球菌屬、大腸桿菌、枸橼菌屬、肺炎桿菌、腸內桿菌屬、沙雷氏菌屬、變形菌屬、綠膿桿菌、淋菌等引起的尿路感染症678例，有效率为83.5%（566例）。其內容為對複雜性尿路感染症239例的有效率为72.0%（172例），對前列腺炎54例的有效率为81.5%（44例），對副睪丸炎34例的有效率为88.2%（30例），對非淋菌性尿道炎111例的有效率为85.6%（95例）。又，以複雜性尿路感染症為對象，作雙重比較試驗，已被認為有效。

婦科領域感染症

對由葡萄球菌屬、大腸桿菌、Peptostreptococcus屬等引起的婦科領域感染症183例，有效率为93.4%（171例），對子宮附件器炎41例的有效率为85.4%（35例），對子宮內感染61例的有效率为95.1%（58例），顯示具有高的有效率。

表淺性化膿性疾患

對由葡萄球菌屬等引起的表淺性化膿性疾患436例（毛囊炎、癰、癰腫、癰等），有效率为89.4%（390例）。

外科・整形外科領域感染症

對由葡萄球菌屬等引起的外科、整形外科領域感染症181例（外傷、手術創傷等的表淺性二次感染等），有效率为80.7%（146例），對乳腺炎29例的有效率为79.3%（23例），對肛門周圍膿瘍23例的有效率为95.7%（22例），對由燙傷引起的表淺性二次感染27例的有效率为77.8%（21例），對外傷、手術創傷等的表淺性二次感染102例的有效率为78.4%（80例）。

肝、膽道感染症

對由肺炎桿菌、綠膿桿菌等引起的膽囊炎、膽管炎26例的有效率为73.1%（19例），此與Ofloxacin的有效率73.9%大約相同。

耳鼻喉科領域感染症

對由葡萄球菌屬、綠膿桿菌等引起的耳鼻喉科領域感染症259例，有效率为75.3%（195例），對外耳炎、中耳炎、副鼻腔炎的任一疾患，亦顯示70%以上的有效率。又，對化膿性唾液腺炎11例的有效率为81.8%（9例）。

眼科領域感染症

對由葡萄球菌，Propiobacterium acnes等引起的眼科領域感染症99例，有效率为91.9%（91例）。對眼瞼炎、麥粒腫39例的有效率为97.4%（38例），對結膜炎25例的有效為80.0%（20例），顯示具有高的臨床效果。

感染性腸炎

對志賀氏桿菌屬、沙門桿菌屬、Campylobacter屬等引起的感染性腸炎122例，有效率为96.7%（118例）。對細菌性赤痢49例的有效率为100%，對沙門桿菌腸炎9例的有效率为100%，對霍亂3例的有效率为100%，對其他感染性腸炎61例的有效率为93.4%（57例），顯示具有高的臨床效果。

齒科口腔外科領域感染症

對由鏈球菌屬、Peptostreptococcus屬、厭氧性鏈球菌屬等引起的齒科口腔外科領域感染症205例，有效率为83.4%（171例）。又，對牙周組織炎73例的有效率为93.2%（68例），對牙冠周圍炎49例的有效率为77.6%（38例），對顎炎83例的有效率为78.3%（65例），顯示具有良好的臨床效果。

副作用及臨床檢查值之變動

於許可前的調查3649例中被提出報告的副作用發生率為2.8%（101例），主要的副作用為下痢、軟便、胃、腹部不快感、想吐、噁心等消化道症狀1.9%（68例），發疹等過敏症狀0.4%（15例）、頭痛、頭重感、失眠等精神神經系症狀0.5%（19例）。又，主要的臨床檢查值的變動為GPT上昇1.9%（46/2，4 39例），GOT上昇1.4%（34/2，422例），嗜酸性球增多1.4%（28/2，063例）等。於許可後的使用成績調查1（2年間），於11,146例中被提出報告的副作用發生率為1.2%（134例），主要的副作用為下痢、腹部不快感等消化器症狀0.6%（65例），GOT、GPT上昇等肝機能異常0.2%（26例）。

生殖試驗

懷孕前，懷孕初期投與試驗

大鼠經口投與至360mg/kg的用量，對雌雄的生殖能力、胎兒無影響。

器官形成期投與試驗

大鼠經口投與至90mg/kg的用量，對胎兒、出生兒無影響。兔子經口投與於50mg/kg的量，對胚胎及胎兒無致死作用，對胎兒也無發育抑制作用，不具有催畸作用。

周產期，授乳期投與試驗

大鼠經口投與至360mg/kg的用量，對母動物的分娩、哺育行動無影響，對初生兒也無影響。

抗原性試驗

對使用免疫增強劑的小鼠，均未產生特異性抗體。於使用實驗作成的致敏動物血清PCA試驗中，雖然小白鼠顯示陽性，但土撥鼠及兔子為陰性，也未出現土撥鼠全身過敏反應。

突變試驗

於使用田鼠(hamster)培養細胞的染色體異常試驗及姊妹染色體交換試驗，雖呈現陽性，但*in vivo*檢討相同的指標時，於小核試驗及骨髓姊妹染色體交換試驗，結果為陰性。進而，於復歸突變試驗，突變誘發頻度試驗，HGPRT試驗，*in vivo*不定期DNA合成試驗及優性致死試驗中皆呈現陰性。

對腎臟的影響

兔子口服10天，腎臟的各種機能及病理組織學檢查結果，用量至120 mg/kg時，無異常發生。

對眼的影響

對有色大鼠以100mg/kg服用14天，進行眼毒害試驗的結果，電氣生理學的機能檢查（網膜電氣圖）及眼科的、病理學的器官檢查皆無變化。

對關節軟骨的影響

對幼小大鼠（3~4週齡）及獵犬（4月齡），服用7天時，大鼠用量300mg/kg以上，獵犬10mg/kg以上，則關節軟骨有發生病變，幼小獵犬易產生關節毒性。又，年輕的成熟犬（13月齡），服用7天，用量於40mg/kg時，有極程度的關節毒性。然而，對18月齡的成熟犬靜脈內投與14天時，用量於30mg/kg未發生關節毒性。

光毒性試驗

照射長波長紫外線（320~400nm），以小白鼠耳殼厚度變化為指標，檢討光毒性的結果，口服200mg/kg時，未發生有意義的變化。

製劑之性狀

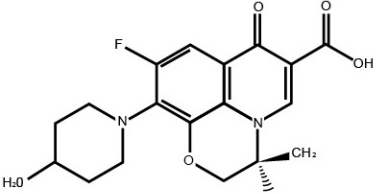
Levofloxacin的理化學性質

一般名：Levofloxacin

略名：LVFX

化學名：（-）-（S）-9-fluoro -2,3 -dihydro-3-methyl-10 -（4-methyl-1-piperazinyl）-7 -oxo -7H -pyrido【1,2,3-*de*】〔1,4〕benzoxazine-6-car -boxylic acid hemihydrate

構造式：



分子式：C₁₈H₂₀FN₃O₄ · 1/2 H₂O

分子量：370.38

熔 點：222~230℃（分解）

性 狀：淡黃白色~黃白色的結晶或結晶性粉末，無臭，味苦。易溶於冰醋酸，略溶於水或甲醇，微溶於乙醇，不溶於乙醚。遇光會產生變化。

賦形劑

croscarmellose sodium, lactose, magnesium stearate, maize starch, polyethylene glycol, povidone, talc.

Coating：

hypromellose, polyethylene glycol, propylene glycol, titanium dioxide.

一般注意事項

貯 法：請置於25℃以下、乾燥陰涼、遠離孩童處

使用期限：記載在外包裝

* 本藥須由醫師處方使用

包裝

4~1000錠塑膠瓶裝、鋁箔盒裝。

委託者：臺碩生技醫藥股份有限公司

地 址：臺北市南京東路二段206號8樓之3

製 造 廠：歐帕生技醫藥股份有限公司

地 址：新竹縣湖口鄉湖南村光復路1號