

耳普欣點耳液 0.3%

Ofloxin Otic Solution 0.3%

(Ofloxacin)

本藥須由醫師處方使用。

禁忌 (請勿對以下患者給藥)

過去對本產品成分或 Levofloxacin 有過敏症病史的患者

【成分】

Each ml contains :

Ofloxacin 3 mg

賦形劑: Benzalkonium Chloride 50%, Hydrochloric Acid,
Sodium Chloride, Sodium Borate, Distilled Water.

【適應症】

成人及小兒外耳炎，成人及青少年鼓膜穿孔之慢性中耳炎、裝有鼓膜造口管的小兒急性中耳炎。

【用法、用量】

成人通常每日給藥兩次，每次將 6 至 10 滴本品滴入耳中，藥水應停留在耳朵內 10 分鐘。劑量(使用次數)則可依據症狀之輕重予以調整。

兒童的使用劑量可能需要減低。

【使用注意事項】

使用本產品之際，為避免出現抗藥菌等，原則上應確認感受性，將給藥限度控制在疾病治療的最短期間內。

1. 謹慎給藥 (對下列患者應謹慎給藥)

過去對其他 Quinolone 類抗菌藥有過敏症病史的患者。

2. 重要基本注意事項

使用本產品之際，期間以 4 週的給藥為基準，其後繼續給藥時，應謹慎小心，並留意因長期給藥所產生的真菌、及細菌的抗藥性等，避免隨意給藥。

3. 副作用(依文獻記載)

副作用發生狀況概要

調查 424 例中出現報告的副作用為 0.5% (2 例)，其明細包括耳痛 0.5% (2 件)、搔癢感 0.2% (1 件)。其中，兒童 (110 例) 並未發現副作用。

此外，實施 100 例聽力檢查後，並未發現聽力衰退。

核准後的使用成績調查 (4 年) 3,381 例，出現的副作用報告為 0.4% (15 例)。主要副作用為耳痛等聽覺和前庭系統障礙 0.2% (6 件)、菌交替症 0.1% (4 件)。其中，兒童 (869 例) 並未發現副作用。

1) 過敏症

出現過敏症狀 (頻率不明^{註)}) 時，應停止給藥。

2) 點耳部位

可能會出現耳痛 (0.1% 以下)、外耳道發紅 (頻率不明^{註)}) 等。

3) 菌交替症

可能會出現菌交替症 (0.1% 以下)。

4) 其他

可能會出現頭痛 (頻率不明^{註)})。

^{註)} 由於屬於自發報告中出現的副作用，故頻率不明。

4. 適用注意事項

1) 給藥路徑：僅可用於點耳。

2) 治療方法：在中耳炎中，若炎症僅出現於中耳黏膜，則適用本產品的局部治療。然而，炎症若擴散至鼓室周邊時，除了本產品的局部治療外，同時建議考慮以口服藥劑進行全身性治療。

3) 給藥時：

(1) 使用之際，由於藥液溫度若過低，可能會引起暈眩，使用時應盡可能在接近體溫的狀態下使用。

(2) 點耳之際，應注意避免使容器尖端直接接觸耳部。

5. 其他注意事項

Ofloxacin 經口給藥時，在動物實驗 (幼犬、幼鼠) 中發現關節異常。

【藥物動態】(依文獻記載)

1. 血中濃度

在成人患者的中耳腔內，採用 0.3% Ofloxacin 水溶液進行 1 次 10 滴、1 天 2 次，共計 14 次的點耳、耳浴，30 分鐘後的血清中濃度僅為 0.009~0.012 $\mu\text{g/mL}$ ¹⁾。此外，在幼兒患者的中耳腔內，採用 0.3% Ofloxacin 水溶液 5 滴進行單次點耳、耳浴，於 120 分鐘內的血清中濃度僅為 0.013 $\mu\text{g/mL}$ 以下²⁾。

參考

1) Ofloxacin 經口給藥中，可能會因與 Phenylacetic Acid 類或 Propionate 類非類固醇性消炎鎮痛藥併用而引發痙攣。儘管如此，利用本產品點耳、耳浴進行局部給藥時，最高血清中濃度與經口給藥相較，僅為 1/100 左右，與這些消炎鎮痛藥併用時，推估誘發痙攣的可能性微乎其微。

2) 對幼兒的 Ofloxacin 經口給藥方面，由於在年幼動物中發現關節異常，尚未確立安全性，因此禁止給藥。儘管如此，利用本產品點耳、耳浴進行局部給藥時，最高血清中濃度與經口給藥相較，僅為 1/100 左右，以幼兒為對象進行的臨床試驗，亦可確認其安全性，故可使用。

2. 分布³⁾

在成人患者的中耳腔內，採用 0.3% Ofloxacin 水溶液進行 1 次 10 滴、1 天 2 次，共計 19 次的點耳、耳浴，90 分鐘後的中耳黏膜中濃度為 19.5 $\mu\text{g/g}$ ，此外，採用 0.1% Ofloxacin 水溶液 10 滴進行單次點耳、耳浴時，30 分鐘後的耳漏中濃度高達 107~610 $\mu\text{g/mL}$ 。

3. 代謝⁴⁾

參考(動物實驗)

對土撥鼠採用 0.3% ¹⁴C-Ofloxacin 水溶液、進行中耳腔內單次給藥，給藥後 0~24 小時的尿中代謝物檢討結果顯示，未變化體占絕大多數 (87%)，去甲基體、N-oxide、葡萄糖醛酸結合體則占極少數。

4. 排泄^{1) 2) 7)}

參考(動物實驗)

對土撥鼠採用 0.3% ¹⁴C-Ofloxacin 水溶液、進行中耳腔內單次給藥，針對尿中及糞便中的放射能排泄加以檢討後發現，給藥後 72 小時內，約 90% 的給藥量皆排泄至尿中，排泄至糞便中的則僅為極少量。

【臨床成績】(依文獻記載)

在日本國內實施，1 天 2 次的點耳、耳浴治療之一般臨床試驗及雙盲比較試驗概要，如下所述。

1. 外耳炎

疾病名稱	有效率 (%) [有效病例/總病例]
外耳炎	81.7 [49/60]
外耳道炎	80.4 [37/46]
鼓膜炎	85.7 [12/14]

2. 中耳炎

疾病名稱	有效率 (%) [有效病例/總病例]
中耳炎	88.1 [141/160]
急性化膿性中耳炎	91.3 [42/46]
慢性化膿性中耳炎急性惡化症	86.0 [74/86]
急性化膿性中耳炎	89.3 [25/28]

此外，以中耳炎為對象，以 Cephalexin 的經口給藥為基礎治療，以安慰劑 (Placebo) 為對照，所實施的雙盲比較試驗中，已證實其有效性。

3. 除菌效果

針對外耳炎、中耳炎所實施的一般臨床試驗中，1 天 1~2 次點耳、耳浴治療病原菌的除菌率方面，金黃色葡萄球菌 (91 株) 中為 97.8% (89 株)、凝固酶陰性葡萄球菌 92.6% (63/68 株)。包括化膿性鏈球菌 (Streptococcus pyogenes) (3 株) 在內的鏈球菌屬 (14 株) 及肺炎球菌 (4 株) 已全數消失。普通變形桿菌 (Proteus vulgaris) (2 株) 皆消失，Proteus mirabilis (6 株) 的消失率則為 83.3% (5 株)，Haemophilus influenzae (6 株) 全數消失，綠膿桿菌 (32 株) 亦全數消失。

【藥效藥理】(依文獻記載)

1. 抗菌作用

Ofloxacin 對革蘭氏 (Gram) 陽性菌組及革蘭氏陰性菌組，擁有廣大的抗菌範圍⁵⁾⁶⁾⁷⁾，針對包括葡萄球菌屬、鏈球菌屬、肺炎球菌、Proteus 屬、Morganella Morganii、Providencia 屬、Haemophilus influenzae、及綠膿桿菌在內的外耳炎、中耳炎病灶起因菌株，發揮抗菌活性。

2. 作用機轉

Ofloxacin 可對細菌的 DNA Gyrase 及 Topoisomerase IV 產生作用，阻礙 DNA 複製^{8)~12)}。抗菌作用屬於殺菌性⁵⁾⁶⁾⁷⁾，MIC 濃度中發現溶菌⁷⁾。

【性 狀】

1. Ofloxacin 點耳液為一微黃色~淡黃色透明溶液，pH 值為 6.0~6.8，滲透壓 270~330mOsm/kg H₂O。

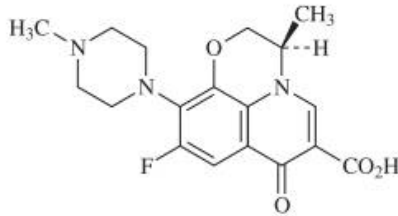
2. 有效成分之物理化學性質

一般名：Ofloxacin

代 號：OFLX

化學名：(3RS)-9-Fluoro-3-methyl-10-(4-methylpiperazin-1-yl)-7-oxo-2,3-dihydro-7H-pyrido [1,2,3-de] [1,4] benzoxazine-6-carboxylic acid

結構式：及鏡像異構體



分子式：C₁₈H₂₀FN₃O₄

分子量：361.37

熔 點：約 265°C (分解)

性 狀：微黃色~淡黃白色的結晶或結晶性粉末。易溶於醋酸 (100%)，不易溶於水，極不易溶於甲基氰 (Acetonitrile) 或酒精 (99.5%)。氫氧化鈉試液溶液 (1→20) 未呈現旋光性。會受到光線影響而變色。

分配係數：三氯甲烷 (Chloroform)—0.1mol/L 磷酸緩衝液 (pH7.4)；4.95 n-Octanol—0.1mol/L 磷酸緩衝液 (pH7.0) ；0.33

【保存方式】

貯存於 25°C 以下。

須置於小孩接觸不到之處。

【包 裝】

100 毫升以下塑膠瓶裝。

衛部藥製字第 059063 號

【主要文獻】

- 1) 石井等人：耳鼻喉科展望 33 (補 4) 595 (1990)
- 2) 馬場等人：耳鼻及臨床 36 (補 3) 590 (1990)
- 3) 馬場等人：耳鼻喉科展望 35 (6) 497 (1992)
- 4) 岡崎等人：耳鼻及臨床 36 (1) 47 (1990)
- 5) 佐藤等人：Chemotherapy 32 (S — 1) 1 (1984)
- 6) 五島等人：Chemotherapy 32 (S — 1) 22 (1984)
- 7) 西野等人：Chemotherapy 32 (S — 1) 62 (1984)
- 8) Fujimoto, T. et al. : Chemotherapy (Basel) 36 268 (1990)
- 9) Imamura, M. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 31 (2) 325 (1987)
- 10) Hoshino, K. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 35 (2) 309 (1991)
- 11) Tanaka, M. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 35 (7) 1489 (1991)
- 12) Tanaka, M. et al. : Antimicrob. Agents Chemother. 41 (11) 2362 (1997)



麥迪森醫藥股份有限公司 桃園廠
桃園市桃園區桃鶯路445-2號
ASEPTIC INNOVATIVE MEDICINE CO.,LTD.
No.445-2, Taoying Rd., Taoyuan Dist., Taoyuan City 330,
Taiwan (R.O.C.)