



撲菌特錠400毫克

BAKTAR TABLETS 400MG

衛署藥製字 第 004919 號

本藥須由醫師處方使用

版本日期 2022-11-07

因可能發生血液異常、休克等嚴重不良反應，請僅在其他藥品無效或無法使用時方考慮投與本藥。[請參考8.1.1、8.1.3]

1 性狀

1.1 有效成分及含量

1錠中含有Sulfamethoxazole 400mg及Trimethoprim 80mg

1.2 賦形劑

Hydroxypropylcellulose (SL)、Carboxymethylcellulose Calcium、Magnesium Stearate

1.3 劑型

錠劑

1.4 藥品外觀

性狀	無臭、味苦、為扁圓形、正面有刻線之白色錠劑。
外觀	正面  反面  側面 
大小	直徑約 11.0mm 厚度約 5.1mm
重量	約 0.50g
識別碼	SHIONOGI 780

2 適應症

葡萄球菌、鏈鎖球菌、肺炎雙球菌、大腸菌、赤痢菌及綠膿桿菌引起之感染症。

2.1 適應症相關之使用注意事項

因多重抗藥性細菌引起上述適應症時，當其他藥品無效或無法使用時方投與本藥。

3 用法及用量

3.1 用法用量

通常成人1日量4錠，分2次口服，但依年齡、症狀得適宜增減。

3.3 特殊族群用法用量

腎損傷病人，請參照下表調整投與量並謹慎投藥。[請參考6.7]

以肌酸酐廓清率(Ccr)為劑量調整指標²⁾³⁾

Ccr(mL/min)	建議劑量
30<Ccr	正常劑量
15≤Ccr≤30	正常劑量的1/2
Ccr<15	不建議投藥

Ccr:肌酸酐廓清率(creatinine clearance rate)

4 禁忌

- 4.1 對本藥中任一成分或磺胺劑曾發生過敏症之病人
- 4.2 孕婦以及可能已懷孕之婦人[請參考6.1]
- 4.3 低出生體重兒、新生兒[請參考6.4]
- 4.4 葡萄糖-六-磷酸鹽去氫酵素(G-6-PD)缺乏症病人[恐有溶血風險]

5 警語及注意事項

5.1 警語/注意事項

- 5.1.1 為避免抗藥性菌的產生，使用本要時，原則上應確認藥物敏感性，以利為疾病治療所需之最短期間內投藥。
- 5.1.2 為能預測血液異常、休克等狀況，請充分問診。
- 5.1.3 開始投藥前，應先對病人說明可能發生之主要不良反應，並指導病人如果認為發生血液異常(有貧血、出血傾向等)、發疹等的皮膚異常時，請儘速與主治醫師聯絡。
- 5.1.4 為提早發現不良反應，於投藥療程中，應進行必要的臨床檢查(含血液檢查、肝功能檢查、腎功能檢查、血中電解質含量等)。[請參考8.1.1-8.1.14]
- 5.1.5 嚴重皮膚不良反應(SCARs)：上市後曾有嚴重皮膚過敏反應，包含「史蒂文生氏強生症候群(SJS)、毒性表皮壞死溶解症(TEN)、急性廣泛性發疹性膿疱症(AGEP)和藥物反應伴隨嗜伊紅性白血球增高及全身症狀症候群(DRESS)」的案例被通報，其中包括致命的案例。如果出現嚴重皮膚不良反應相關症狀或癥候，應立即停藥並給予適當臨床處置。

5.4 實驗室檢測

- 5.4.1 與methotraxate併用時，因拮抗二氫葉酸還原酶的效果加乘，請注意methotraxate濃度可能偏高。
- 5.4.2 請注意肌酸酐值(Jaffe's 反應等)可能偏高。

6 特殊族群注意事項

6.1 懷孕

懷孕或可能懷孕之婦女，請勿投藥。

曾有報告指出，於孕期中單獨或併用本藥時，該病人之新生兒出現先天畸形之案例。此外，在動物實驗中有催畸形作用。(大鼠每日口服投與1200mg/kg以上時，造成骨骼異常、內臟異常、外觀異常；小鼠每日口服投與3000mg/kg時，造成顎裂)。[請參考4.2]

6.2 哺乳

請考慮治療益處和母乳餵養的益處，投藥期間考慮繼續或停止母乳餵養。本藥會分泌至乳汁中

，使得低出生體重兒、新生兒發生高膽紅素血症。

6.4 小兒

請勿對低出生體重兒、新生兒投藥。可能會造成高膽紅素血症。

6.5 老年人

請留意用量等謹慎投藥。本藥主要透過腎臟排泄，因老年人腎功能常常較低，恐造成藥物血中濃度持續偏高的可能。

6.6 肝功能不全

有時會有肝功能惡化的情況。[請參考8.1.8]

6.7 腎功能不全

因血中藥物濃度持續偏高，請考慮減量等方式。[請參考3.3, 11.5.1]

6.8 其他族群

6.8.1 有併發症/病史的病人

6.8.1.1 血液異常病人以及既往曾有血液異常之病人，除非確定無法避免，否則請勿給藥。可能血液疾病惡化。[請參考8.1.1]

6.8.1.2 本人及雙親、兄弟容易引起支氣管喘息、發疹、蕁麻疹等過敏性體質患者，或者曾對其他藥物發生過敏症之病人，除非確定無法避免，否則請勿給藥。

6.8.1.3 葉酸缺乏或代謝異常的病人(曾進行胃部切除手術、服用其他抗葉酸劑、產後、先天性葉酸代謝異常等病人)，會使葉酸缺乏情況惡化，有時會引起巨母紅血球性貧血。[請參考8.1.1]

7 交互作用

Trimethoprim 是肝臟酵素CYP2C8 抑制劑。[請參考11.6]

7.1 併用藥物注意事項(併用時注意)

藥品名	臨床症狀、處置方法	作用機轉、危險因子
抑制葉酸代謝的藥品 Methotrexate [請參考8.1.1]	增加Methotrexate作用，有時會出現全血細胞減少等症狀。	皆有抑制葉酸代謝作用。
Sulfadoxine·Pyrimethamine [請參考8.1.1]	與Pyrimethamine併用，有時會出現巨母紅血球性貧血	
Diaphenylsulfone [請參考8.1.1, 11.6]	與Diaphenylsulfone併用，有時會出現血液異常(巨母紅血球性貧血、全血細胞減少等)。	皆有抑制葉酸代謝作用，此外Trimethoprim 為CYP2C8抑制劑。
Repaglinide [請參考11.6]	使Repaglinide血液濃度上升。	Trimethoprim 為CYP2C8抑制劑。

Sulfonylurea類口服糖尿病用藥

藥品名	臨床症狀、處置方法	作用機轉、危險因子
Gliclazine、Glibenclamide等 [請參考8.1.12]	增強前述藥物降血糖效果，有時會出現低血糖症狀。	本藥會抑制此類藥物經肝代謝作用。
Coumarin類抗凝血劑 Warfarin potassium	增強Coumarin類抗凝血劑的作用，有時會有出血症狀。	
Phenytoin	增強Phenytoin作用。	本藥會抑制Phenytoin經肝代謝作用。
Cyclosporine [請參考8.1.9]	增加腎損傷症狀。	皆有腎毒性。 危險因子:特別是腎臟移植後病人。
Tacrolimus hydrate [請參考8.1.9]		皆有腎毒性。
Zidovudine	增加Zidovudine毒性，有時會出現顆粒球減少等症狀。	機轉不明。
Ganciclovir、Valganciclovir hydrochloride	有報告指出，Ganciclovir之廓清率減少12.9%、藥物半衰期延長18.1%、Trimethoprim 之C _{min} 值增加 12.7%。	機轉不明。
含Lamivudine藥品	報告指出，Lamivudine 之AUC增加43%，總清除率減少30%，腎廓清率減少35%。	本藥之Trimethoprim，會使前述藥物的腎小管分泌作用降低。
Digoxin類藥品	使Digoxin的血中濃度上升。	
三環抗憂鬱藥 Clomipramine hydrochloride、Imipramine hydrochloride、Amitriptyline hydrochloride等	使三環抗憂鬱藥效果減弱	機轉不明。
血管收縮素受體阻斷劑Olmesartan、Medoxomil等。 血管收縮素轉化酵素抑制劑Enalapril maleate等。 醛固酮拮抗劑、保鉀利尿劑Spironolactone等。 [請參考8.1.13]	與前述藥物併用，有時會產生高血鉀症狀。	皆使血鉀濃度上升。

因有下列不良反應出現的可能性，故請充分觀察，發現異狀時請停止給藥並進行適當處置。

8.1 臨床重要副作用/不良反應

重大不良反應

- 8.1.1 再生不良性貧血、溶血性貧血、巨母紅血球性貧血、高鐵血紅蛋白血症、顆粒性白血球缺乏症、血小板減少(以上頻率不明)。[請參考特殊警語, 5.1.4, 6.8.1.1, 6.8.1.3, 7.1]
- 8.1.2 血栓性血小板減少紫癩(TTP)、溶血性尿毒症候群(HUS) (以上頻率不明):
有可能發生TTP(主要徵狀: 血小板減少、溶血性貧血伴隨破碎的紅血球出現、神經精神症狀、發熱、腎損傷)、HUS(主要徵狀: 血小板減少、溶血性貧血伴隨破碎的紅血球出現、急性腎損傷)，應留心觀察血液檢查(血小板、紅血球等) 及腎功能檢查結果，發現異常時請停止給藥並進行血漿置換等適當處置。[請參考5.1.4]
- 8.1.3 休克(小於0.1%)、過敏反應(以上頻率不明):
初期症狀:不適感、口內異常感、喘鳴、暈眩、便意、耳鳴、出汗、浮腫等)。[請參考特殊警語, 5.1.4]
- 8.1.4 嚴重皮膚不良反應(SCARs)上市後曾有嚴重皮膚過敏反應，包含「史蒂文生氏強生症候群(SJS)、毒性表皮壞死溶解症(TEN)、急性廣泛性發疹性膿疱症(AGEP)和藥物反應伴隨嗜伊紅性白血球增高及全身症狀症候群(DRESS)」的案例被通報，其中包括致命的案例。
- 8.1.5 藥物過敏症候群2)(頻率不明):
初期症狀為皮疹、發熱，此外可能伴隨肝損傷、淋巴結腫脹、白血球數增加、嗜酸性白血球增多、非典型淋巴球出現等遲發性嚴重過敏症狀，故請充分觀察，如有上述症狀出現請停止給藥並進行適當處置。另外，多伴隨第六型人類疱疹病毒(HHV-6)等再活化現象，即使停藥後，仍請注意皮疹、發熱、肝損傷等症狀可能復發或延長。[請參考5.1.4]
- 8.1.6 急性胰臟炎(頻率不明)[請參考5.1.4]
- 8.1.7 伴隨血便之嚴重大腸炎(如：偽膜性大腸炎等)(頻率不明):
腹痛、頻繁腹瀉時，請採取立即停藥等適當處置。[請參考5.1.4]
- 8.1.8 重度肝損傷(頻率不明) [請參考5.1.4, 6.6]
- 8.1.9 急性腎損傷、間質性腎炎(頻率不明)[請參考5.1.4, 7.1]
- 8.1.10 無菌性腦膜炎、末梢神經炎(頻率不明)[請參考5.1.4]
- 8.1.11 間質性肺炎、間質性肺氣腫(PIE)(頻率不明)(發熱、咳嗽、呼吸困難、胸部X光異常、嗜酸性白血球增多等)[請參考5.1.4]
- 8.1.12 低血糖(頻率不明)[請參考5.1.4, 7.1]
- 8.1.13 高血鉀、低血鈉症 (頻率不明):
有時會出現電解質異常狀況，發現異常時請停止給藥並進行電解質異常矯正等適當處置。[請參考5.1.4, 7.1]
- 8.1.14 橫紋肌溶解症 (頻率不明):
出現肌肉痛、無力感、血清肌酸激酶(Creatine Kinase)上升、血中或尿中肌紅蛋白濃度上升等橫紋肌溶解之症狀。此外伴隨著急性腎功能惡化、急性腎損傷等嚴重症狀。[請參考

其他不良反應

頻 率	0.1~0.5%	<0.1%	頻率不明
種類			
血液		顆粒球減少	血小板減少
過敏	皮疹、搔癢	紅斑	水疱、蕁麻疹、光過敏
皮膚			皮膚血管炎(白血球細胞破裂性血管炎、IgA血管炎等)
消化系 統	食慾不振、噁心、嘔吐、腹瀉、便秘、腹痛、胃不適感、舌炎、口角炎、口腔炎	口渴	血便
肝臟		AST(GOT)上升、ALT(GPT)上升	黃疸、ALP上升
腎臟			腎損傷(BUN上升、血尿等)
神經精 神系統	頭痛	暈眩、頭昏眼花感、麻痺感	顫抖、無力、疲倦感、嗜睡狀態
其他	發熱、覺得熱	血壓下降、胸悶、出汗、血紅素尿	關節痛、肌肉疼痛、葡萄膜炎、血壓上升、心悸、臉潮紅、浮腫

9 過量

9.1 臨床症狀：

出現想吐、嘔吐、腹瀉、神經精神症狀(頭痛、暈眩等)、結晶尿、血尿等。

9.2 處置方法：

依據症狀進行洗胃、催吐、通過強迫利尿促進腎排泄、血液透析(腹膜透析無效)等。[請參考11.5.1]

10 藥理特性

10.1 作用機轉

Sulfamethoxazole能抑制微生物體內葉酸之生合成，Trimethoprim則能抑制葉酸之活化，而

發揮抗菌作用。兩種成分之併用，因為對細菌之葉酸代謝過程之連續兩處同時予以抑制，故能發揮加乘性抗菌作用。

10.2 藥效藥理特性

抗菌作用

試管試驗中發現，相較於單獨使用之藥效，Sulfamethoxazole與Trimethoprim兩藥併用時，能使抗菌作用加乘，進而具殺菌作用。對腸球菌屬、大腸桿菌、赤痢菌、傷寒桿菌、副傷寒桿菌、檸檬酸桿菌屬、克雷伯氏菌屬、腸內菌屬、變形桿菌屬、摩根氏桿菌屬、雷氏普威登斯菌及流感嗜血桿菌具有抗菌作用。

10.3 臨床前安全性資料

大鼠動物實驗中，有時會有甲狀腺機能異常現象發生。

11 藥物動力學特性

11.1 血中濃度

11.1.1 健康成人

健康成人飯後單次口服投與2錠後，血中濃度變化與藥物動力學如圖11-1、表11-1所示3)。

圖11-1 口服投與時之血中濃度

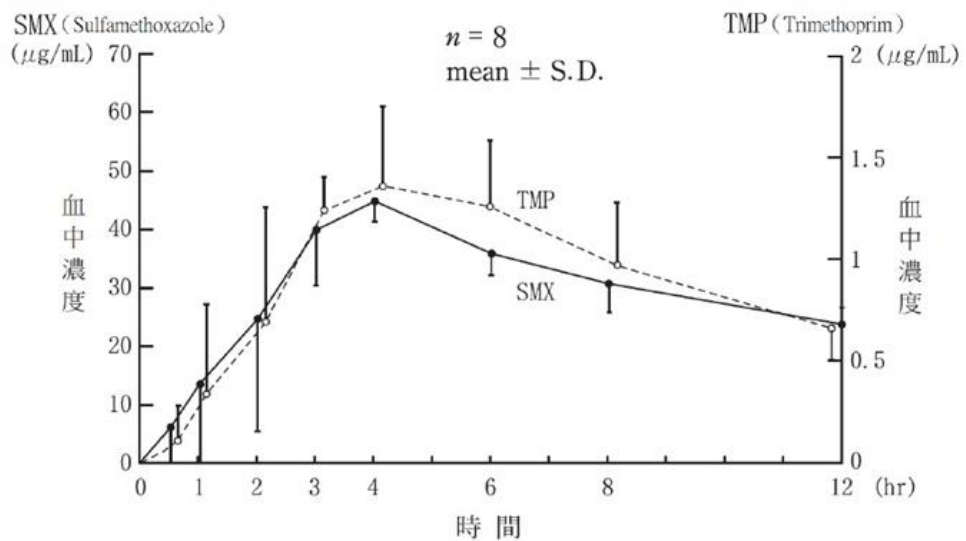


表11-1 藥物動力學參數

投與量 (錠)	n		C_{max} (µg/mL)	T_{max} (hr)	AUC_{0-12} (µg·hr/mL)	$T_{1/2}$ (hr)
2	8	SMX	46.8±3.9	3.4±0.9	352.83±53.09	7.8±0.8
		TPM	1.46±0.31	3.3±0.7	11.10±2.30	6.8±1.2

SMX : HPLC

TMP : 氣相層析法
(平均值±標準偏差)

11.1.2 圖11-2顯示了空腹時健康成年人的單次口服 2g血漿濃度，表11-2顯示了藥物動力學參



圖11-2口服投與時之血中濃度

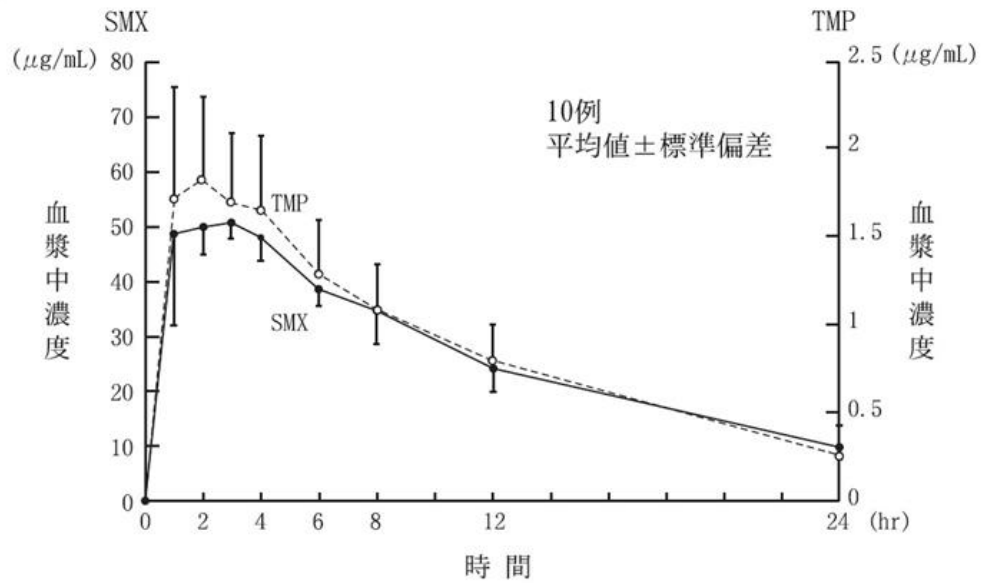


表11-2 藥物動力學參數

投與量 (錠)	n		C_{max} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	T_{max} (hr)	AUC_{0-12} ($\mu\text{g}\cdot\text{hr}/\text{mL}$)	$T_{1/2}$ (hr)
2	10	SMX	58.0 ± 6.5	1.7 ± 0.7	675.49 ± 100.73	9.4 ± 1.6
		TPM	2.06 ± 0.34	2.0 ± 1.2	21.74 ± 4.06	8.2 ± 3.7

SMX：HPLC

TMP：氣相層析法
(平均值±標準偏差)

11.2 分布

11.2.1 蛋白結合率

Sulfamethoxazole:約50~60% (血漿·超濾法)⁶⁾。Trimethoprim:約42% (血清·血液透析法)⁷⁾。

11.3 代謝

於健康成人1例·口服Sulfamethoxazole 4g·確認尿中代謝。部分Sulfamethoxazole會於體內代謝為N4-acetyl-sulfamethoxazole、glucuronyl-sulfamethoxazole⁸⁾。

部分Trimethoprim會於大鼠體內代謝為3-demethyl-trimethoprim、4-demethyl-trimethoprim得葡萄糖酸化合物(glucuronide conjugate)及 trimethoprim-N-oxide⁹⁾。

11.4 排泄

健康成人6例·單次口服投與2錠·其sulfamethoxazole及trimethoprim之尿中濃度於24小時內約為60%·48小時內約為70~85%¹⁰⁾。

11.5 特殊背景的病人

11.5.1 腎損傷病人



口服投與sulfamethoxazole-trimethoprim 複方錠2錠(sulfamethoxazole 800mg、trimethoprim 160mg)予肌酸酐廓清率為4mL/min 以下之尿毒症病人4例，其sulfamethoxazole及trimethoprim血清中藥物平均半衰期分別於未透析時為 28.4小時及 22.8小時、透析時為11.1小時及 9.4小時¹¹⁾。(外國人資料)[請參考6.7]

11.6 藥物交互作用

- 1) Sulfamethoxazole會抑制肝臟酵素CYP2C9¹⁴⁾ (in vitro)
- 2) Trimethoprim會抑制肝臟酵素CYP2C8¹²⁾ 及有機陽離子轉運蛋白(OCT2)¹⁵⁾ (in vitro) 。[請參考7., 7.1]

12 臨床試驗資料

目前尚無資訊。

13 包裝及儲存

13.1 包裝

8~1000錠鋁箔盒裝、塑膠瓶裝。

13.2 效期

如外包裝所示。

13.3 儲存條件

請以密閉容器保存於30°C以下、避光處。

14 病人使用須知

14.1 藥物交付時:

請指導病人如何自PTP鋁箔包裝取出本藥。(報告指出，如誤食PTP鋁箔片，可能使其尖銳處刺入食道粘膜，甚至引起穿孔導致縱膈膜炎等嚴重併發症)。

15 其他

15.1 物理化學特性

15.1.1 Sulfamethoxazole 的物理化學性質

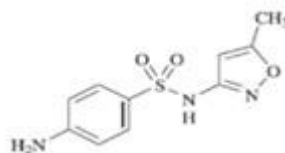
一般名: Sulfamethoxazole

化學名:4-Amino-N-(5-Methylisoxazoly-3-yl)_benzenesulfonamide

分子式: C₁₀H₁₁N₃O₃S

分子量:253.28

化學結構式:



性狀:白色結晶或結晶性粉末，無臭，味略苦，

極易溶於N,N-Dimethylformamide、略難溶於乙醇(95%)、難溶於乙醚、極難溶於水。

可溶於氫氧化鈉試劑、



照光後會逐漸變色。

熔點: 169~172°C

分配係數:7.76[1-octanol/水]

15.1.2 Trimethoprim的物理化學性質

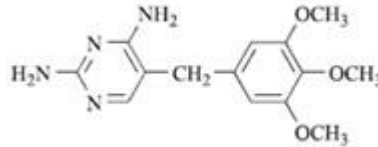
一般名: Trimethoprim

化學名:2,4-Diamino-5- (3,4,5- trimethoxybenzyl) - pyrimidine

分子式:C₁₄H₁₈N₄O₃

分子量:290.32

化學結構式:



性狀: 白色結晶或結晶性粉末，無臭，味苦。

易溶於醋酸(100%)，略難溶於甲醛、西醋酸、三氯甲烷，難溶於乙醇(95%)、丙酮，極難溶於水，幾乎不溶於乙醚。

熔點：199~203°C

分配係數:4.37[pH7.4 · l-octanol/緩衝液]

15.2 主要文獻

[文獻請求編號]

- 1) 厚生勞動省，健康局，結核病和傳染病科：正確使用抗菌劑指南
- 2) Rieder, J.等:Antibiotic. Chemother. 1974;18: 148-198
[200101129]
- 3) T.T. Yoshikawa: J. Am. Geriatric. Soc. 1990; 38: 1353-1372
[200101123]
- 4) 厚生勞動省：嚴重藥物不良反應疾病因應手冊：藥物。
過敏症候群。
(http://www.info.pmda.go.jp/juutoku/juutoku_index.html)
- 5) 神木照雄：內部資料(單次投與時的血中濃度)
[190000631]
- 6) 酒井克治等：最新醫學。1959;14:3139-3146
[195900028]
- 7) 深谷一太等: [Chemotherapy, 1973; 21: 273-282
[197300218]
- 8) 岡本三郎: 最新醫學, 1960; 15: 1882-1890
[196000118]
- 9) 飯照彥等:Chemotherapy, 1973; 21: 229-231
[197300201]
- 10) 大久保一衛等:Chemotherapy, 1973; 21: 241-245
[197300213]
- 11) Craig. W. A. 等: Ann. Intern. Med. 1973;78: 491-497
[200101122]

111.11.07

- 12) Nissenson. A. R. 等: Am. J. Nephrol. 1987; 7: 270-274
[202000236]
- 13) Walker. S. E. 等: Perot. Dial. Int. 1989; 9:51-55
[198902300]
- 14) Wen. X. 等: Drug Metab. Dispos. 2002; 30: 631-635
[201700297]
- 15) Jung. N. 等: Drug Metab. Dispos. 2008; 36: 1616-1623
[201700298]

廣效性合成抗菌劑
Sulfamethoxazole、Trimethoprim製劑



IT-2080-07

⑦

修訂日期：2022年11月1日

製造廠

杏輝藥品工業股份有限公司

宜蘭縣冬山鄉中山村中山路 8 4 號

電話：(03)9581101(代表號)

藥商

台灣塩野義製藥股份有限公司

台北市南京東路二段 2 號 4 樓

電話：(02)25516336(代表號)