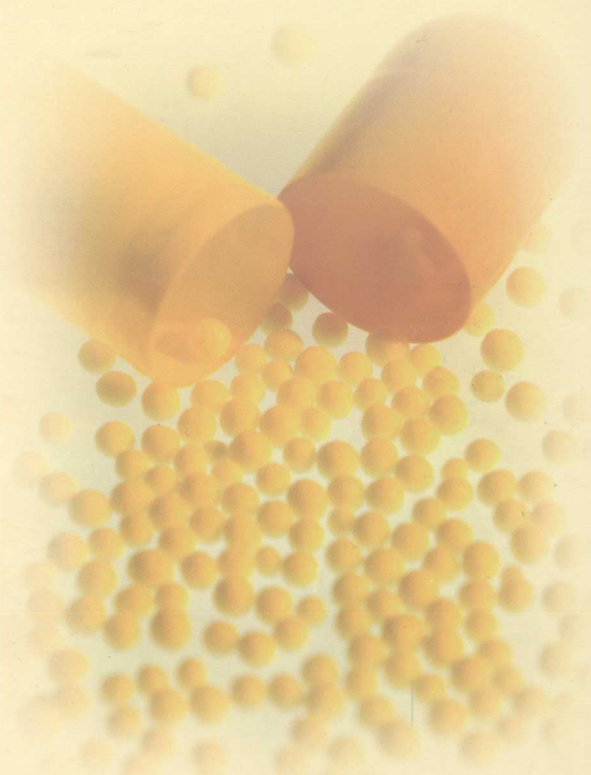


齐鲁医丛

杨文学 主编

抗生素的临床应用参考

郭志彩 著



国际文化出版公司

抗生素的临床应用参考

郭志彩 著

国际文化出版公司

图书在版编目 (C I P) 数据

抗生素临床应用参考/ 郭志彩著. —北京: 国际文化出版公司, 2008. 8

(齐鲁医丛)

ISBN 978-7-80173-812-7

I. 抗… II. 郭… III. 抗生素—临床应用 IV. R978. 1

中国版本图书馆CIP数据核字 (2008) 第121617号

齐鲁医丛

- | | |
|------|----------------------------|
| 主 编 | 杨文学 |
| 责任编辑 | 李璞 陈杰平 张妮莹 王逸明 潘建农 宋亚晖 |
| 封面设计 | 杨牧原 |
| 出版发行 | 国际文化出版公司 |
| 经 销 | 北京国文润华图书销售公司 |
| 印 刷 | 山东省临沂第二印刷厂 |
| 开 本 | 880×1230 32开 |
| 字 数 | 2750千字 |
| 版 次 | 2008年8月第一版
2008年8月第一次印刷 |
| 书 号 | ISBN 978-7-80173-812-7 |
| 定 价 | 198.00元 (全九册) |

国际文化出版公司地址

北京朝阳区东土城路乙9号 邮编 100013

电话: 64271187 64279032

传真: 64271499

E-mail: icpc@95777sina.net

http://www.sinoread.com

目 录

第一章	青霉素类.....	1
第二章	β -内酰胺酶抑制药.....	63
第三章	头孢菌素类	91
第四章	其他 β -内酰胺类	196
第五章	氨基糖苷类.....	220
第六章	四环素类.....	259
第七章	大环内酯类.....	278
第八章	氯霉素类.....	318
第九章	万古霉素类	327
第十章	林可霉素类.....	335
第十一章	多粘菌素类	345
第十二章	其它抗生素	349

第一章 青霉素类

青霉素钠 (Benzylpenicillin Sodium)

【别名】

苄基青霉素钠盐、苄青霉素钠、青霉素 G 钠

【临床应用】

1. 适用于治疗溶血性链球菌(A组、B组)、肺炎链球菌、对青霉素G敏感金黄色葡萄球菌等革兰阳性球菌所致的各种感染,如败血症、肺炎、脑膜炎、扁桃体炎、中耳炎、猩红热、丹毒、产褥热等。
2. 适用于治疗草绿色链球菌和肠球菌感染性心内膜炎;也适用于风湿性心脏病或先天性心脏病病人手术前预防心内膜炎的发生。
3. 适用于治疗梭状芽孢杆菌所致的破伤风、气性坏疽、炭疽、白喉、流行性脑脊髓膜炎、李斯特菌病、鼠咬热、梅毒、淋病、回归热、钩端螺旋体病、雅司病、奋森咽峡炎、放线菌病等。

【药理】

1. 药效学

◇作用机制 本药属天然青霉素类药,是一种繁殖期杀菌药。其作用机制是通过干扰细菌细胞壁的合成而产生抗菌作用。研究结果提示青霉素结合蛋白(PBPs)是青霉素等 β -内酰胺类抗生素的作用靶位。由于青霉素等与PBPs的紧密结合,使前者对细菌细胞壁合成的早期阶段发生抑制作用。

PBPs为存在于细菌胞质膜上的蛋白,其数目、分子大小和青霉素等抗生素的结合量因细菌菌种不同而异。PBPs具有催化粘肽代谢酶的功能,如转肽酶反应;也有研究发现PBPs是参与细胞壁生物合成的对

青霉素敏感的酶，如转肽酶、羧肽酶、内肽酶等。PBP-1B 和 PBP-1A 为使细菌延长的最重要蛋白，经青霉素作用后可使细菌迅速溶解；PBP-2 与控制细菌形态有关，受青霉素作用后，细菌可形成渗透压稳定的球形体；PBP-3 对细菌细胞中隔膜形成和细菌分裂有重要作用，PBP-4、PBP-5、PBP-6 则重要性较差。

◇抗菌谱 革兰阳性球菌：溶血性链球菌(A、B、C、G、F组)、不产青霉素酶的金黄色葡萄球菌、敏感的肺炎链球菌和厌氧的阳性球菌。

革兰阳性杆菌：白喉棒状杆菌、炭疽芽孢杆菌、厌氧的破伤风梭菌、产气荚膜梭菌、肉毒梭菌、放线菌属、真杆菌属、丙酸杆菌。革兰阴性球菌：脑膜炎奈瑟菌、淋病奈瑟菌、卡他莫拉菌。螺旋体：梅毒螺旋体、钩端螺旋体、鼠咬热螺菌等。

2. 药动学

口服吸收差，但肌注或静脉给药后吸收良好。肌注 100 万 U(600mg)，0.5 小时后可达血药浓度峰值，约为 $12\mu\text{g/ml}$ 。对多数敏感菌的有效血药浓度可维持 5 小时。新生儿肌注 2.5 万 U/kg，0.5~1 小时后平均血药浓度峰值约为 $22\mu\text{g/ml}$ 。5 分钟内静脉注射 500 万 U(3g)，5 分钟和 10 分钟后的平均血药浓度分别 $400\mu\text{g/ml}$ 、 $273\mu\text{g/ml}$ ；1 小时即降至 $45\mu\text{g/ml}$ ，4 小时后降至 $3\mu\text{g/ml}$ 。6 小时内静脉滴注相同剂量药物，2 小时后可获得 $12\sim 20\mu\text{g/ml}$ 的血药浓度。

药物吸收后可广泛分布于各组织、体液中。在胸、腹腔和关节腔液中浓度约为血药浓度的 50%；在乳汁中浓度为血药浓度的 5%~20%。易透入有炎症的组织，也可透过胎盘，除在妊娠前 3 个月羊水中药物浓度较低外，一般在胎儿和羊水中均可获得有效治疗浓度。本药还可进入红细胞，如作静脉注射，继以恒速静脉滴注，2 小时后红细胞中药物浓度与血药浓度相等或超过后者。本药不易透入眼、骨组织、无血供区域和脓肿腔中，也难以透过血-脑脊液屏障。在无炎症脑脊液中的浓度仅为血药浓度的 1%~3%，在有炎症的脑脊液中浓度可达血药浓度的 5%~30%。

本药血浆蛋白结合率为 45%~65%。半衰期约为 30 分钟，肾功能减退者半衰期可延长至 2.5~10 小时；老年和新生儿半衰期也较长，

且新生儿的半衰期与体重、年龄有关。约 19% 的药物在肝内代谢。肾功能正常情况下，约 70% 的注射量于 6 小时内经肾脏排出。健康成年人主要通过肾小管排泄药物，经肾小球排泄者仅占 10% 左右；新生儿则主要经肾小球排泄。肌肉注射 50 万 U(300mg) 后，平均 19% 的给药量经尿液以青霉噻唑酸排出。另有少量药物经胆汁排泄，粪便中药物含量很少(药物在下消化道中可被产青霉素酶的肠道菌所破坏)。血液透析可有效清除本药，但腹膜透析无此作用。

【注意事项】

1. 交叉过敏 对一种青霉素类药过敏者可能对其他青霉素类药过敏，也可能对青霉胺或头孢菌素类药过敏。

2. 禁忌症 对本药或其他青霉素类药过敏者。

3. 慎用 (1) 有哮喘、湿疹、枯草热、荨麻疹等过敏性疾病史者。(2) 肾功能严重损害者。(3) 老年人。

4. 药物对哺乳的影响 本药可分泌入乳汁中，哺乳期妇女应用本药虽尚无发生严重问题的报道，但用药后可使婴儿致敏和引起腹泻、皮疹、念球菌属感染等，因此，应用时须权衡利弊。

5. 药物对妊娠的影响 美国食品与药物管理局(FDA)对本药的妊娠危险性分级为 B 级。

6. 药物对检验值或诊断的影响 (1) 以硫酸铜法进行尿糖测定时可呈假阳性，用葡萄糖酶法测定则不受影响。(2) 大剂量给药时可出现血清钠浓度升高。(3) 少数患者用药后可出现血清丙氨酸氨基转移酶、天门冬氨酸氨基转移酶升高。

7. 用药前后及用药时应当检查或监测 大剂量用药时应定期检测血清钠浓度。

【不良反应】

1. 过敏反应 本药毒性虽低，但过敏反应较常见，总发生率约为 0.7%~10%。用药后可发生严重的过敏反应，如过敏性休克(I 型变态反应)和血清病型反应(III 型变态反应)。其他过敏反应尚有溶血性贫血(II 型变态反应)、药疹、接触性皮炎、哮喘发作等。

2. 毒性反应 较少见。肌注区可发生周围神经炎。鞘内注射超过 2

万 U 或静脉大剂量滴注可引起青霉素脑病(肌肉阵挛、抽搐、昏迷等反应)。此反应多见于婴儿、老年人和肾功能减退患者。有报道大剂量用药后偶可引起一过性精神病发作,但发生机制尚不明确。

3. 二重感染 治疗期间可出现耐青霉素金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌或白念珠菌感染。念珠菌过度繁殖可使舌苔呈棕色甚至黑色。

4. 赫氏反应和治疗矛盾 治疗梅毒或其他感染时可有症状加剧现象,称赫氏反应。治疗梅毒患者时由于用药后梅毒病灶消炎过快,但组织修补过迟,或纤维组织收缩,妨碍器官功能,也可能出现治疗矛盾。

5. 血液系统 少数有凝血功能缺陷的患者,大剂量用药可干扰凝血机制,导致出血倾向。

6. 其他 青霉素钠 100 万 U(0.6g)含钠离子 1.7mmol(0.039g)。大剂量给药后,可造成高钠血症,少数患者还可出现低血钾,代谢性碱中毒等。在肾功能减退或心功能不全患者中尤易发生。

【药物相互作用】

1. 与丙磺舒合用可减少本药排泄,升高血药浓度;但毒性也可能增加。

2. 与阿司匹林、吲哚美辛、保泰松同用可减少本药在肾小管的排泄,升高血药浓度,延长血浆半衰期;但毒性也可能增加。

3. 与磺胺类药同用可减少本药在肾小管的排泄,升高血药浓度,延长血浆半衰期;但毒性也可能增加。

4. 与华法林同用可加强华法林的抗凝血作用。

5. 与甲氨蝶呤同用时,由于相互竞争肾小管分泌,可降低甲氨蝶呤的肾脏清除率,增加甲氨蝶呤毒性。

6. 与四环素、红霉素、氯霉素等抑菌药同用可能使本药抗菌作用降低,可能的机制为相互拮抗作用(氯霉素、红霉素、四环素类、磺胺药等抑菌剂可干扰本药的杀菌活性)。在治疗脑膜炎或急需杀菌剂的严重感染时不宜与这些药合用。

7. 与考来烯胺同用可降低本药的吸收,可能的机制是青霉素能被考来烯胺结合。

8. 与考来替泊同用时,可使本药血药浓度降低 78%~79%,血药

浓度-时间曲线下面积(AUC)减少75%~85%。

9. 与避孕药同用可降低避孕药的药效,可能的机制为减少避孕药的肠肝循环。

10. 与伤寒活疫苗同用可降低伤寒活疫苗的免疫效应,可能的机制是本药对伤寒沙门菌具有抗菌活性。

11. 口服给药时,食物可延迟本药吸收,降低血药峰值浓度。

【用法与用量】

◇常规剂量

肌肉注射:每日80万~200万U,分3~4次给药。

静脉滴注:每日200万~1000万U,分2~4次给药。

◇肾功能不全时剂量

轻、中度肾功能损害患者,使用常规剂量。严重肾功能损害患者须调整剂量或延长给药时间:(1)肾小球滤过率(GFR)为10~15ml/min时,给药间隔为8~12小时或剂量减少25%。(2)GFR小于10ml/min时,给药间隔为12~18小时或剂量减至正常剂量的25%~50%。

◇儿童常规剂量

肌肉注射:(1)小儿常用量:每次2.5万U/kg,每12小时1次。

(2)新生儿(足月产)剂量:每次5万U/kg。出生第1周患儿,每12小时1次;大于7天患儿,每8小时1次;严重感染患儿,每6小时1次。(3)早产儿剂量:每次3万U/kg。第1周患儿,每12小时1次;2~4周患儿,每8小时1次;4周后患儿,每6小时1次。

静脉滴注:(1)小儿常用量:每日5万~20万U/kg,分2~4次给药。(2)新生儿(足月产)剂量:每次5万U/kg。出生第1周患儿,每12小时1次;大于7天患儿,每8小时1次;严重感染患儿,每6小时1次。(3)早产儿剂量:每次3万U/kg。第1周患儿,每12小时1次;2~4周患儿,每8小时1次;4周后患儿,每6小时1次。

【制剂与规格】

注射用青霉素钠(每1mg的青霉素钠相当于1670个青霉素单位)(1)0.12g(20万U)。(2)0.24g(40万U)。(3)0.48g(80万U)。(4)0.6g(100万U)。(5)0.96g(160万U)。(6)2.4g(400万U)。贮藏:

密闭，在凉暗干燥处保存。

青霉素钾 (Benzylpenicillin potassium)

【别名】

苄基青霉素钾、苄基青霉素钾盐、苄基青霉素钾盐粗品、苄青霉素钾、青霉素G钾

【临床应用】

1. 适用于治疗溶血性链球菌(A组、B组)、肺炎链球菌、对青霉素G敏感金黄色葡萄球菌等革兰阳性球菌所致的各种感染，如败血症、肺炎、脑膜炎、扁桃体炎、中耳炎、猩红热、丹毒、产褥热等。

2. 适用于治疗草绿色链球菌和肠球菌感染性心内膜炎；也适用于风湿性心脏病或先天性心脏病病人手术前预防心内膜炎的发生。

3. 适用于治疗梭状芽孢杆菌所致的破伤风、气性坏疽、炭疽、白喉、流行性脑脊髓膜炎、李斯特菌病、鼠咬热、梅毒、淋病、回归热、钩端螺旋体病、雅司病、奋森咽峡炎、放线菌病等。

【药理】

1. 药效学

◇作用机制 本药属天然青霉素类药，是一种繁殖期杀菌药。其作用机制是通过干扰细菌细胞壁的合成而产生抗菌作用。研究结果提示青霉素结合蛋白(PBPs)是青霉素等 β -内酰胺类抗生素的作用靶位。由于青霉素等和PBPs紧密结合，使前者对细菌细胞壁合成的早期阶段产生抑制作用。

◇抗菌谱 革兰阳性球菌：溶血性链球菌(A、B、C、G、F组)、不产青霉素酶的金黄色葡萄球菌、敏感的肺炎链球菌和厌氧的阳性球菌。

革兰阳性杆菌：白喉棒状杆菌、炭疽芽孢杆菌、厌氧的破伤风梭菌、产气荚膜梭菌、肉毒梭菌、放线菌属、真杆菌属、丙酸杆菌。革兰阴性球菌：脑膜炎奈瑟菌、淋病奈瑟菌、卡他莫拉菌。螺旋体：梅毒螺旋体、钩端螺旋体、鼠咬热螺菌等。

2. 药动学

口服吸收差，但肌注或静脉给药后吸收良好。肌注 100U (600mg)，

0.5 小时后可达血药浓度峰值, 约为 $12 \mu\text{g/ml}$ 。对多数敏感菌的有效血药浓度可维持 5 小时。5 分钟内静脉注射 500 万 U(3g), 5 分钟和 10 分钟后的平均血药浓度分别为 $400 \mu\text{g/ml}$ 、 $273 \mu\text{g/ml}$; 1 小时即降至 $45 \mu\text{g/ml}$, 4 小时后降至 $3 \mu\text{g/ml}$ 。6 小时内静脉滴注相同剂量药物, 2 小时后可获得 $12 \sim 20 \mu\text{g/ml}$ 的血药浓度。

药物吸收后可广泛分布于各组织、体液中。在胸、腹腔和关节液中浓度约为血药浓度的 50%; 在乳汁中浓度为血药浓度的 5%~20%。易透入有炎症的组织, 也可透过胎盘, 除在妊娠前 3 个月羊水中药物浓度较低外, 一般在胎儿和羊水中均可获得有效治疗浓度。本药还可进入红细胞, 如作静脉注射, 继以恒速静脉滴注, 2 小时后红细胞中药物浓度与血药浓度相等或超过后者。本药不易透入眼、骨组织、无血供区域和脓肿腔中, 也难以透过血-脑脊液屏障。在无炎症脑脊液中的浓度仅为血药浓度的 1%~3%, 在有炎症的脑脊液中浓度可达血药浓度的 5%~30%。

本药血浆蛋白结合率为 45%~65%。半衰期约为 30 分钟, 肾功能减退者半衰期可延长至 2.5~10 小时; 老年和新生儿半衰期也较长, 且新生儿的半衰期与体重、年龄有关。约 19% 药物在肝内代谢。肾功能正常情况下, 约 70% 的注射量于 6 小时内经肾脏排出。健康成年人主要通过肾小管排泄药物, 经肾小球排泄者仅占 10% 左右; 新生儿则主要经肾小球排泄。另有少量药物经胆汁排泄, 粪便中药物含量很少(药物在下消化道中可被产青霉素酶的肠道菌所破坏)。血液透析可清除本药, 但腹膜透析无此作用。

【注意事项】

1. 交叉过敏 对一种青霉素类药过敏者可能对其他青霉素类药过敏, 也可能对青霉胺或头孢菌素类药过敏。

2. 禁忌症 对本药或其他青霉素类药过敏者。

3. 慎用 (1) 有哮喘、湿疹、枯草热、荨麻疹等过敏性疾病史者。(2) 肾功能严重损害者。(3) 老年人。

4. 药物对哺乳的影响 本药可分泌入乳汁中, 哺乳期妇女应用本药虽尚无发生严重问题的报道, 但用药后可使婴儿致敏和引起腹泻、皮

疹、念球菌属感染等，因此，应用时须权衡利弊。

5. 药物对妊娠的影响 美国食品与药物管理局(FDA)对本药的妊娠危险性分级为B级。

6. 药物对检验值或诊断的影响 (1)以硫酸铜法进行尿糖测定时可呈假阳性，用葡萄糖酶法测定则不受影响。(2)大剂量给药时可出现血清钾浓度升高。(3)少数患者用药后可出现血清丙氨酸氨基转移酶、天门冬氨酸氨基转移酶升高。

7. 用药前后及用药时应当检查或监测 大剂量用药时应定期检测血清钾浓度。

【不良反应】

1. 过敏反应本药毒性虽低，但过敏反应较常见，总发生率约为0.7%~10%。用药后可发生严重的过敏反应，如过敏性休克(I型变态反应)和血清病型反应(III型变态反应)。其他过敏反应尚有溶血性贫血(II型变态反应)、药疹、接触性皮炎、哮喘发作等。

2. 毒性反应 较少见。肌注区可发生周围神经炎。鞘内注射超过2万U或静脉大剂量滴注可引起青霉素脑病(肌肉阵挛、抽搐、昏迷等反应)。此反应多见于婴儿、老年人和肾功能减退患者。有报道大剂量用药后偶可引起一过性精神病发作，但发生机制尚不明确。

3. 二重感染 治疗期间可出现耐青霉素金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌或白念珠菌感染。念珠菌过度繁殖可使舌苔呈棕色甚至黑色。

4. 赫氏反应和治疗矛盾 治疗梅毒或其他感染时可有症状加剧现象，称赫氏反应。治疗梅毒患者时由于用药后梅毒病灶消炎过快，但组织修补过迟，或纤维组织收缩，妨碍器官功能，也可能出现治疗矛盾。

5. 血液系统 少数有凝血功能缺陷的患者，大剂量用药可干扰凝血机制，导致出血倾向。

6. 其他 青霉素钾 100 万U(0.625g)含钾离子 1.5mmol(0.066g)，如静脉大剂量给药时，可发生高钾血症或钾中毒反应。

【药物相互作用】参见青霉素钠的药物相互作用部分。

【用法与用量】

◇常规剂量

肌肉注射：每日 80 万~200 万 U，分 3~4 次给药。

静脉滴注：每日 200 万~1000 万 U，分 2~4 次给药。

◇肾功能不全时剂量

轻、中度肾功能损害患者，使用常规剂量。严重肾功能损害患者须调整剂量或延长给药时间：(1) 肾小球滤过率 (GFR) 为 10~15ml/min 时，给药间隔为 8~12 小时或剂量减少 25%。(2) GFR 小于 10ml/min 时，给药间隔为 12~18 小时或剂量减至正常剂量的 25%~50%。

◇儿童常规剂量

肌肉注射：(1) 小儿常用量：每次 2.5 万 U/kg，每 12 小时 1 次。

(2) 新生儿(足月产)剂量：每次 5 万 U/kg。出生第 1 周患儿，每 12 小时 1 次；大于 7 天患儿，每 8 小时 1 次；严重感染患儿，每 6 小时 1 次。(3) 早产儿剂量：每次 3 万 U/kg。第 1 周患儿，每 12 小时 1 次；2~4 周患儿，每 8 小时 1 次；4 周后患儿，每 6 小时 1 次。

静脉滴注：(1) 小儿常用量：每日 5 万~20 万 U/kg，分 2~4 次给药。(2) 新生儿(足月产)剂量：每次 5 万 U/kg。出生第 1 周患儿，每 12 小时 1 次；大于 7 天患儿，每 8 小时 1 次；严重感染患儿，每 6 小时 1 次。(3) 早产儿剂量：每次 3 万 U/kg。第 1 周患儿，每 12 小时 1 次；2~4 周患儿，每 8 小时 1 次；4 周后患儿，每 6 小时 1 次。

【制剂与规格】

注射用青霉素钾(每 1mg 的青霉素钾相当于 1598 个青霉素单位)(1)0.125g(20 万 U)。(2)0.25g(40 万 U)。(3)0.5g(80 万 U)。(4)0.625g(100 万 U)。贮法：密闭，在凉暗干燥处保存。

青霉素 V 钾 (Phenoxymethylpenicillin Potassium)

【别名】

苯氧甲基盘尼西林钾、苯氧-甲基-盘尼西林-钾盐、苯氧甲基青霉素钾、苯氧甲基青霉素钾盐、美格西、青霉素-VK、青霉素 V 钾盐

【临床应用】

1. 适用于治疗敏感菌所致的轻、中度感染，包括链球菌所致的扁桃体炎、咽喉炎、猩红热、丹毒；肺炎链球菌所致的支气管炎、肺炎、中耳炎、鼻窦炎；敏感葡萄球菌所致的皮肤软组织感染等。
2. 也适用于治疗螺旋体感染。
3. 还可作为风湿热复发和感染性心内膜炎的预防用药。

【药理】

1. 药效学

◇作用机制 青霉素 V 为口服耐酸不耐酶的半合成青霉素类药。作用机制同青霉素 G 相似，通过与青霉素结合蛋白(PBPs)结合，导致细胞壁破坏，细菌溶解，从而起抗菌作用。

青霉素 V 钾为青霉素 V 的钾盐，其吸收比青霉素 V 游离酸快而完全，血药浓度比游离酸高 2~5 倍。

本药虽然对青霉素酶不稳定，但被青霉素酶灭活比青霉素 G 稍慢，对某些金黄色葡萄球菌的作用略强于青霉素 G；但对大多数敏感菌株的抗菌活性比青霉素 G 弱 2~5 倍。本药特点是耐酸、口服吸收明显优于青霉素 G。

◇抗菌谱 对葡萄球菌、链球菌、肺炎链球菌等革兰阳性球菌及梅毒螺旋体具有很强的活性；对白喉棒状杆菌、炭疽杆菌、梭状芽孢杆菌、牛放线菌、念珠状链杆菌、单核细胞增多性李斯菌、钩端螺旋体及淋病奈瑟菌也有一定的作用。

2. 药动学

口服后不被破坏，在胃中不分解。药物主要在十二指肠吸收，吸收率为 60%。口服 0.5g，1 小时后达血药浓度峰值，约为 3~5mg/L。药物吸收后广泛分布于各组织、体液中。本药易透入有炎症的组织，可透过胎盘，在乳汁中也有一定的含量，但不易透入眼、骨组织、无血供区域和脓肿腔中，也难以透过血-脑脊液屏障。

本药血浆蛋白结合率为 75%~80%，半衰期约为 0.5 小时。给药量的 56% 经肝脏代谢失活，主要经肾随尿液排泄。其中约 20%~35% 以原形排出，约 34% 以水解产物青霉噻唑酸排出。血液透析可有效清

除药物，但腹膜透析无此作用。

【注意事项】

1. 交叉过敏 对一种青霉素类药过敏者可能对其他青霉素类药过敏，也可能对青霉胺或头孢菌素类药过敏。

2. 禁忌症 (1) 对本药或其他青霉素类药过敏者。(2) 传染性单核细胞增多症患者。

3. 慎用 (1) 有哮喘、湿疹、枯草热、荨麻疹等过敏性疾病史者。(2) 肾功能严重损害者。(3) 孕妇或哺乳期妇女。(4) 老年人。

4. 药物对妊娠的影响 本药可透过胎盘进入胎儿体内，故孕妇慎用。

5. 药物对哺乳的影响 本药可分泌入母乳中，可能使婴儿致敏并引起腹泻、皮疹、念球菌属感染等，故哺乳期妇女慎用或暂停哺乳。

6. 药物对检验值或诊断的影响 (1) 以硫酸铜法进行尿糖测定时可出现假阳性，用葡萄糖酶法测定则不受影响。(2) 大剂量给药时可出现血清钾浓度升高。(3) 少数患者用药后可出现血清丙氨酸氨基转移酶或天门冬氨酸氨基转移酶升高。

7. 用药前后及用药时应当检查或监测 长期、大剂量用药时应检测血清钾浓度。

【不良反应】

1. 胃肠道 反应较多见，主要表现为恶心、呕吐、上腹部不适、腹泻等症状。

2. 过敏反应 可出现皮疹(多见于传染性单核细胞增多症者)、荨麻疹、药物热、喉水肿、嗜酸粒细胞增多等；极少见过敏性休克。

3. 二重感染 长期或大剂量用药可出现耐青霉素金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌或白念珠菌感染(舌苔呈棕色甚至黑色)。

4. 其他 少数患者用药后偶可出现溶血性贫血、白细胞减少、血小板减少、神经毒性及肝、肾毒性等。

【药物相互作用】

1. 克拉维酸可增强本药对产 β -内酰胺酶细菌的抗菌活性。

2. 氨基糖苷类药在亚抑菌浓度时可增强本药对粪肠球菌的体外杀

菌作用。

3. 与丙磺舒合用可减少本药排泄，升高其血药浓度。

4. 与阿司匹林、吲哚美辛、保泰松合用可减少本药排泄，升高其血药浓度。

5. 与磺胺类药同用可减少本药在肾小管的排泄，升高其血药浓度。

6. 与华法林等抗凝血药合用可加强抗凝药的抗凝血作用。

7. 与甲氨蝶呤合用时，由于相互竞争肾小管分泌，可使甲氨蝶呤的肾脏清除率降低，血药浓度升高，增加甲氨蝶呤毒性。

8. 与四环素、红霉素、氯霉素等抑菌药同用可降低本药抗菌作用。可能的机制为相互拮抗作用(氯霉素、红霉素、四环素类、磺胺药等抑菌剂可干扰本药的杀菌活性)。在治疗脑膜炎或急需杀菌剂的严重感染时青霉素V钾不宜与这些药合用。

9. 与考来烯胺同用可降低本药吸收。可能的机制是青霉素被考来烯胺结合。

10. 与考来替泊同用可使本药血药浓度降低78%~79%，血药浓度-时间曲线下面积(AUC)减少75%~85%。

11. 与避孕药同用可刺激雌激素代谢或减少其肠肝循环，从而降低口服避孕药的药效。

12. 与伤寒活疫苗合用可降低伤寒活疫苗的免疫效应。可能的机制是本药对伤寒沙门菌有抗菌活性。

13. 食物可减少本药吸收。

【用法与用量】

◇常规剂量

口服给药：(1)链球菌感染：每次125~250mg，每6~8小时1次，疗程10日。(2)肺炎球菌感染：每次250~500mg，每6小时1次，疗程至退热后至少2日。(3)葡萄球菌感染、螺旋体感染(奋森咽峡炎)：每次250~500mg，每6~8小时1次。(4)预防风湿热复发：每次250mg，每日2次。(5)预防细菌引起的心内膜炎：手术前1小时服用2g，手术后6小时再服用1g。

◇肾功能不全时剂量

根据肌酐清除率调整剂量。

◇儿童常规剂量

口服给药：每次 2.5~9.3mg/kg，每 4 小时 1 次；或每次 3.75~14mg/kg，每 6 小时 1 次；或每次 5~18.7mg/kg，每 8 小时 1 次。

【制剂与规格】

青霉素 V 钾片 (1) 0.125g (20 万 U)。 (2) 0.25g (40 万 U)。 (3) 0.5g (80 万 U)。 贮法：遮光、密闭，在凉暗处保存。青霉素 V 钾颗粒 (1) 0.05g。 (2) 0.125g。 (3) 0.25g。 贮法：遮光、密闭，在凉暗处保存。青霉素 V 钾干糖浆 (1) 1ml：0.125g。 (2) 1ml：0.25g。 贮法：置于密闭容器中，在室温下干燥处保存。

普鲁卡因青霉素 (Procaine Benzylpenicillin)

【别名】

苄青霉素普鲁卡因、普鲁卡因青霉素 G、普青、青霉素普鲁卡因

【临床应用】

1. 可用于治疗对青霉素 G 高度敏感的 A 组溶血性链球菌所致的扁桃体炎、猩红热、丹毒、肺炎球菌肺炎、青霉素 G 敏感金黄色葡萄球菌所致的疖、痈等皮肤软组织感染、奋森咽峡炎。

2. 尚可用于治疗钩端螺旋体病、回归热和早期梅毒等。

【药理】

1. 药效学

◇作用机制 普鲁卡因青霉素为青霉素 G 的一种长效肌肉注射用药，是普鲁卡因与青霉素 G 的等克分子复合物。其作用机制与青霉素 G 相同，系通过与青霉素结合蛋白 (PBPs) 结合，导致细胞壁破坏，细菌溶解，从而产生抗菌作用。

本药的作用特点是吸收缓慢，血药浓度维持时间较长且达峰时间慢。在临床所用的普鲁卡因青霉素制剂内，除普鲁卡因青霉素外，含有一定量的青霉素 G (钠或钾)，两者之比为 3：1。其中青霉素 G 吸收快，半小时达峰值，迅速发挥抗菌作用；普鲁卡因青霉素则缓慢吸收，维持较长时间的血药浓度，发挥其长效的特点。