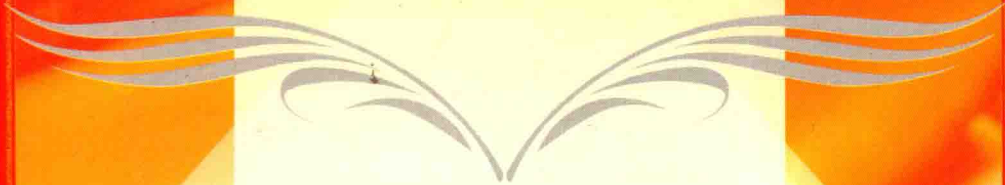
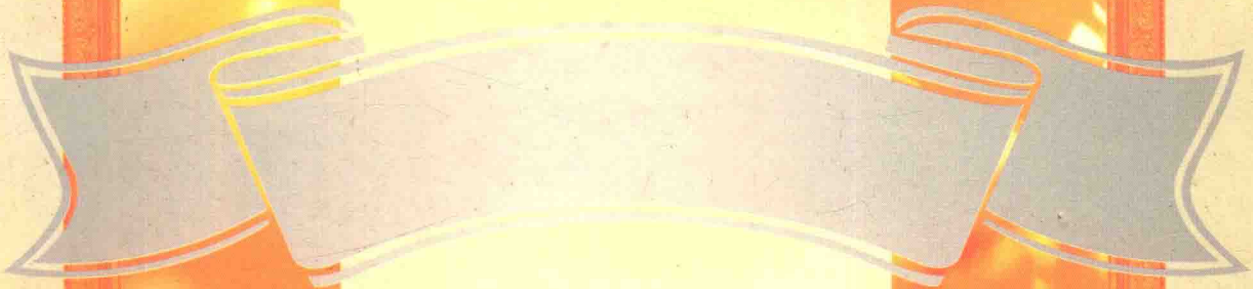


LIN CHUANG YONG
YAO XU ZHI

临床用药须知

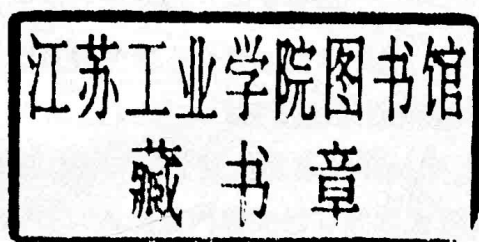


天津电子出版社

临床用药须知

(第四卷)

主编 徐 浩



天津电子出版社

头孢替安

Cefotiam

【异名】 头孢噻乙胺唑，头孢噻四唑，泛司博林，凡是颇灵。

【作用特点】 体内分布广，在胆汁、肾组织中浓度高，超过血药浓度，但难以透过血脑屏障，血清半衰期 0.6~1.1h，50%以原形从尿中排泄。其药动学特点是表观分布容量很高，反映药物透入血管外体液和组织的浓度高，使感染部位的浓度能达到充分杀灭病原菌的水平。本品对革兰阳性菌的作用与头孢唑啉相似，对革兰阴性杆菌如大肠杆菌、肺炎杆菌、摩根杆菌、伤寒杆菌、志贺菌属、流感杆菌和奈瑟菌属有良好抗菌活性，但对其他肠杆菌科细菌、不动杆菌属和铜绿假单胞菌敏感性差或耐药；对除脆弱类杆菌外的多数厌氧菌有较好的抗菌作用。

【适应证和用法】 用于治疗敏感菌所致的呼吸道、泌尿道和外科感染。

成人每日 1~2g，严重感染可用至 6g，分 2~4 次肌注、静注或静滴。肌注时可用 0.25%利多卡因或专用溶液溶解。

【临床合理应用】

不良反应：主要是皮疹、药物热、血清转氨酶升高等。

禁忌证：对头孢菌素类药物过敏者禁用。

注意事项：①严重肾功能不全者应适当减量；②避免与强利尿剂合用。

【临床评价】 临床应用于 20 203 例感染性疾病患者，总有效率达 81.3%；其中对败血症的有效率为 67.1%，对呼吸道感染的有效率为 77.1%~96%，对胆道感染的有效率为 77.6%~88.8%，对腹腔内感染的有效率为 84.5%，对泌尿系统感染的有效率为 68.1%~88.7%，对骨关节、皮肤软组织和伤口感染的有效率为 58.3%~93.3%，对妇科感染的有效率为 67.8%~100%。对细菌学阳性的 9 343 例患者，有效率达 83.7%，其中对革兰阳性菌的有效率为 84%，对革兰阴性菌的有效率为 83.5%。

【制剂】 注射用粉剂：0.5g/支，1.0g/支。

头孢替安酯

Cefotiam Hexetil

【作用特点】 本品为头孢替安酯的口服制剂，通过酯化制成前体药物，从而改善了吸收。空腹口服吸收好（生物利用度 45.5%），血清半衰期 0.8h。皮肤水泡液中浓度高，对大多数皮肤软组织致病菌有效；40%的药物 8h 内经尿排出。其抗菌谱和抗菌活

性完全与头孢替安相同。对革兰阳性菌的活性优于头孢氨苄和头孢克洛，而对革兰阴性杆菌的活性明显强于头孢克洛。

【适应证和用法】 用于敏感菌所致的呼吸道、泌尿道、皮肤、副鼻窦等感染。

成人每日 0.6~1.2g，分 3 次口服。

【临床合理应用】

不良反应：发生率约为 3.6%，主要有腹泻和软便、呕吐、腹痛、皮疹等，少数患者可见血清转氨酶升高、嗜酸性粒细胞增多，停药后迅速改善。

禁忌证：对头孢菌素类药物过敏者禁用。

注意事项：①严重肾功能不全者应适当减量；②避免与强利尿剂合用。

【临床评价】 国内报道成人口服头孢替安酯 100~200mg，每日 3 次，疗程 3~14d，治疗各种感染，临床疗效极好。治疗呼吸道感染的有效率为 72%~90%，治疗尿路感染的有效率为 78%，治疗软组织感染的有效率为 82%。另一项双盲对照试验，给细菌性肺炎患者分别口服本品 600mg/d，或头孢克洛 1500mg/d，共 14 天，临床有效率分别为 80% 和 83%。

【制剂】 片剂：100mg/片，200mg/片。

(2) 第二代头孢菌素的其他常用药物：

第二代头孢菌素的其他常用药物

通用名 (英文名)	异名	作用特点	适应证和用法	临床应用要点
头孢尼西 Cefonicid		伤口渗液及组织浓度较高；血清蛋白结合率 98%，血清半衰期 4.4 h，主要以原形从尿中排泄	用于敏感菌所致的尿路、呼吸道感染、淋病、皮肤软组织及骨感染等。成人每日 1~2g，分 1~2 次肌注或静滴	①不良反应有局部疼痛、静脉炎、皮疹、药物热、肝肾功能异常等；②对本品过敏者禁用；③对青霉素过敏者慎用
头孢雷特 Ceforanide	头孢氨甲 苯唑	血清蛋白结合率 81%~88%，血清半衰期 2.5~3h，主要以原形从肾小球滤过排泄	可用于治疗肺炎、败血症、心内膜炎和骨髓炎。成人每次 0.5~2g，每 12h 1 次，肌注或静脉给药；儿童每日 20~80mg/kg，分 2 次给药	①对本品过敏者禁用；②对青霉素过敏者慎用
氯碳头孢 Loracarbef	罗拉碳头 孢，乐君毕	口服后在皮肤水疱液、中耳液和扁桃体等体液组织中分布良好；血清半衰期 1~1.2 h，87%~97% 的药物 24h 内经尿排出	用于敏感菌所致的呼吸道、泌尿道、皮肤软组织感染。成人每日 0.4~0.8g，分 2 次口服；儿童每日 30mg/kg，分 2 次口服	①对本品过敏者禁用；②对青霉素过敏者慎用

3. 第三代头孢菌素

对革兰阳性菌作用弱，对革兰阴性菌有强大的抗菌活性，抗菌谱更广，某些品种对铜绿假单胞菌有较强作用；对 β 内酰胺酶高度稳定；有一定量渗入炎症脑积液中；对肾脏毒性很低。

(1) 第三代头孢菌素的主要常用药物：

头孢曲松

Ceftriaxone

【异名】 头孢三嗪，氨噻三嗪头孢菌素，头孢三秦噻肟，头孢泰克松，罗氏芬(菌必治)，菌得治，果复每，丽珠芬，罗塞秦，亚松，安迪芬，安塞隆，赛福松，泛生舒复，丽康可松，先嗪。

【作用特点】 本品的特点是血清半衰期长，具有长效作用。口服不吸收，肌注或静注后清除半衰期8~8.5h，连续注射后有20%积蓄现象；组织体液中药物浓度高，包括脓性痰、胸水、腹水、滑膜液、前列腺液、皮肤水泡液、子宫和输卵管、骨等组织，能透过血脑屏障，到达炎症或非炎症脑膜。血浆蛋白结合率90%~95%。本品在体内不被代谢，51%~60%的药物从尿中排泄，约40%的药物以原形自胆管肠道排出，丙磺舒不能增高和延长本品的血药浓度。抗菌谱广，抗菌活力强，与头孢噻肟相似，尤其对肠杆菌科细菌具强大抗菌作用，对流感杆菌、淋病奈瑟菌和脑膜炎奈瑟菌的抗菌活性在第三代头孢菌素中最强，其中对淋球菌作用强大，包括产青霉素酶菌株(PPNG)、耐四环素淋球菌(TRNG)和染色体介导性耐药淋球菌(MRNG)，为目前无合并症淋球菌感染的首选药物；对大肠杆菌、肺炎杆菌、产气杆菌、弗劳地枸橼酸杆菌、吡啶阳性变形杆菌、普罗菲登菌属和沙雷菌属作用亦强，但对铜绿假单胞菌、不动杆菌、阴沟杆菌活性弱；对甲氧西林敏感金黄色葡萄球菌、溶血性链球菌、肺炎链球菌作用好，但MRSA和肠球菌对本品耐药；多数脆弱类杆菌耐药，其他厌氧菌和放线菌对本品尚敏感。

【适应证和用法】 用于敏感菌所致的呼吸系统、耳鼻咽喉、泌尿系统感染，脓毒血症，脑膜炎，骨髓炎，皮肤和软组织感染，生殖系统感染，预防术后感染。

成人每次0.5~2g，每日1次，肌注、静注或静滴；严重感染时每次1~2g，每12h一次，但不宜超过4g/d。婴幼儿每次20~80mg/kg，每日1次。疗程视病情而定。尿路感染多采用肌注，每次250~500mg，淋球菌尿道炎则采用一剂疗法，剂量为250mg(125~500mg)。

【临床合理应用】

不良反应：包括胃肠道反应如腹泻、恶心、呕吐、口炎、舌炎等；皮肤过敏反应如皮疹、皮炎、瘙痒、荨麻疹、水肿、多形红斑；血液系统有嗜酸性粒细胞增多、血小板减少、白细胞减少、出血或血肿、溶血性贫血。其他罕见不良反应有头痛、头晕、ALT、AST、Cr一过性升高、生殖系统霉菌感染。少数患者静注后会发生静脉炎。

禁忌证：对头孢菌素过敏、孕妇（特别是首3个月）禁用。

注意事项：①与其他 β 内酰胺类抗生素有交叉过敏反应，青霉素过敏者慎用；②肾功能减退者的肌酐清除率高于0.250 5ml/s者，剂量可不加调整，低于0.250 5ml/s者或肝肾功能均有减退者，应于用药第二日起调整剂量；③与氨基糖苷类抗生素合用时应分别给药；④对于维生素K合成障碍及维生素储备不足（如慢性肝脏疾病、营养不良）等患者，须监测凝血酶原时间，适当补充维生素K。

【临床评价】 本品的特点是半衰期长达8h，每天一剂即能保持24h有效血药浓度，从而可以减少患者每天给药次数，增加门诊患者治疗的依从性，减少医护人员的工作量，尤其适用于心功能不良需限制液体输入的老年患者；另一特点是经肾脏和肝胆两种途径排泄，肾功能不全时肝胆排泄增加，肝功能不全时肾脏排泄增加，故临床应用中一般无须调整剂量。临床治疗下呼吸道感染的有效率为97.8%，尿路感染的有效率为98.5%，腹腔内感染的有效率为92.8%，骨骼和关节感染的有效率为95.7%，皮肤及软组织感染的有效率为94.5%，细菌性败血症的有效率为96.1%。细菌清除率为82.8%~98.8%。

【制剂】 粉针剂：0.25g/支，0.5g/支，1.0g/支；注射液：1g/50ml，2g/50ml。

头孢地秦

Cefodzime

【异名】 莫敌威，莫迪，莫敌，高德。

【作用特点】 化学结构与头孢噻肟和头孢曲松相似，其抗菌谱和抗菌活性也与这两者相似。肌注后生物利用度为90%~100%，小儿肌注后的生物利用度较低，为70%。血浆蛋白结合率81%~88%，在各种体液或组织中浓度高，能进入腹水、胆汁、脑脊液、肺、肾、子宫内膜及盆腔组织等；平均血清半衰期2.5h左右，小儿较短，大多为1.4~2.3h，老年患者和肾功能减退者可延长；在体内不代谢，51%~94%的药物以原形从尿中排出，多次给药后粪中可排出给药量的11%~30%，胆汁中浓度很高。对革兰阳性和革兰阴性需氧菌具有广谱抗菌活性，尤其对肠杆菌科细菌等革兰阴性杆菌

有强大抗菌活性。MRSA、表皮葡萄球菌、肠球菌、铜绿假单胞菌和其他假单胞菌、肠杆菌属、枸橼酸杆菌、阴沟杆菌属、乙酸钙不动杆菌、嗜麦芽窄食单胞菌及黏质沙雷菌对本品耐药。

【适应证和用法】 用于敏感菌所致耳鼻咽喉感染、支气管炎、肺炎、肺脓肿、子宫内膜炎、盆腔感染、胆道感染、血液病合并感染，预防外科术后感染、淋球菌感染及小儿各种感染。

成人每日 2~4g，分 1~2 次肌注、静注或静滴；儿童每日 60mg/kg，分 2~3 次给药。单纯性尿路感染和淋病 1~2g 单剂给药；细菌性脑膜炎每日 200mg/kg，分 4 次给药。

【临床合理应用】

不良反应：以恶心、呕吐、腹痛、腹泻等胃肠道反应常见；皮疹、红斑、瘙痒、头晕和头痛次之；局部有疼痛和静脉炎等反应；偶见 ALT、AST、ALP 及胆红素升高。

禁忌证：对头孢菌素过敏者禁用。

注意事项：对青霉素或其他 β 内酰胺类抗生素过敏的患者存在交叉过敏的可能。肾功能减退者宜调整给药剂量，与氨基糖苷类抗生素同时使用时，必须监测肾功能。

【临床评价】 临床疗效与其他第三代头孢菌素类似，其特点是具有免疫调节活性，可用于免疫抑制和免疫缺陷患者。有作者报道，应用头孢地秦治疗 301 例下呼吸道感染（包括肺炎、急性支气管炎、慢性支气管炎急性发作）的患者，临床有效率为 88%，细菌清除率为 90%，老年患者的临床疗效与年轻患者相同。应用本品治疗成人和儿童由流感嗜血杆菌、肺炎链球菌和脑膜炎双球菌引起的化脓性脑膜炎，临床有效率达 88%，无后遗症，其中儿童的疗效要优于成人。国外有作者报道，应用本品治疗 91 例慢性呼吸道感染患者 7~10 天后，最常见的致病菌如流感嗜血杆菌、卡他莫拉菌（不产 β 内酰胺酶）和肺炎链球菌均被清除，产 β 内酰胺酶的卡他莫拉菌对本品的敏感性较差。

【制剂】 粉针剂：0.5g/支，1.0g/支，2g/支。

头孢他啶 Ceftazidime

【异名】 头孢塔齐定，头孢齐定，头孢羧甲噻肟、头孢噻甲羧肟，复达欣，凯复定，安塞定，丽珠锐欣，舒而欣，新天欣，先定，益他欣，罗抗。

【作用特点】 给药后能有效地在各种体液和组织中达到治疗浓度，易通过胎盘屏障，但很难透过正常的血脑屏障，血清半衰期为 1.7~2.1 h，健康老年人可延长至

2.4h; 血浆蛋白结合率 10% ~ 17%, 24h 内 83% ~ 87% 药物以原形自尿中排出。目前是针对铜绿假单胞菌最强的头孢菌素, 同时对绝大多数致病原如金黄色葡萄球菌、化脓性链球菌、肺炎链球菌、大肠杆菌、克雷伯菌属、变形杆菌属、沙雷菌属、淋球菌、脑膜炎球菌及厌氧菌均敏感。但对 MRSA、肠球菌属、难辨梭菌、李斯特菌耐药。

【适应证和用法】 用于敏感菌所致的严重感染如败血症、菌血症、腹膜炎、脑膜炎、血液病或实体性恶性肿瘤患者因免疫抑制而合并的感染; 也适用于烧伤、呼吸道、泌尿道、耳鼻咽喉、皮肤和软组织、胃肠道、胆道系统及腹部、盆腔、骨和关节等部位的感染。

成人每日 1.5 ~ 6g, 分 2 ~ 3 次肌注、静注或静滴, 肌注一般加用 1% 的利多卡因 0.5ml; 儿童每日 50 ~ 150mg/kg, 分 3 次给药。尿路感染每次 0.25 ~ 0.5g, 每 12h 1 次; 肾功能中度或严重损害者须调整剂量, 分别为每 12 ~ 24h 1g 和每 24 ~ 48h 0.5g; 老年人感染时剂量可减少至正常量的 1/2 ~ 2/3。

【临床合理应用】

不良反应: 较少, 静脉用药时, 可引起静脉炎和血栓性静脉炎。偶见斑丘疹、瘙痒、发热、腹泻、头痛、眩晕、感觉异常及味觉不佳。实验室检查可见转氨酶轻度升高, 嗜酸性粒细胞增多, Coombs 试验阳性, 血小板增多。

禁忌证: 对头孢菌素类过敏者禁用。

注意事项: ①与呋喃苯氨酸等高效利尿剂或其他影响肾功能的药物合用会增加肾毒性; ②不可与万古霉素、碳酸氢钠配伍; ③妊娠早期、婴幼儿慎用; ④长期大剂量使用时应警惕发生二重感染。

【临床评价】 本品对革兰阴性菌, 尤其是铜绿假单胞菌有强大的抗菌活性, 是目前临床上治疗危重感染, 尤其是铜绿假单胞菌感染的首选抗菌用药。国内北京医院报道, 应用头孢他啶 2g, 每日 2 次, 疗程 7 ~ 10 天治疗 70 例严重肺部感染患者, 总有效率为 80%, 细菌清除率为 70%。另有一组报告, 对 51 例颅脑损伤并发肺炎的患者应用本品静滴, 另 44 例应用头孢唑啉和氨苄西林静滴, 两组治愈率分别为 94.1% 和 63.6% ($P < 0.05$)。头孢他啶治疗老年人严重下呼吸道感染的有效率达 82.5%。

【制剂】 粉针剂: 0.5g/支, 1g/支, 1.5g/支, 2g/支, 3g/支。

头孢哌酮

Cefoperazone

【异名】 头孢氧哌唑, 头孢氧哌羟苯唑, 先锋哌唑酮, 先锋必素, 先锋必, 麦道

必(头孢必), 赛福必, 达诺欣, 赛必欣, 利君派同, 泰普欣, 施乐欣, 先抗, 先必先, 先平。

【作用特点】 本品为对铜绿假单胞菌有良好作用的第三代头孢菌素。可透过胎盘屏障, 但难以透过血脑屏障; 体内多数组织和体液分布广, 胆汁中浓度最高。血清蛋白结合率 80%, 血清半衰期 1.99 ~ 2.45h。尿中排出给药量的 30%, 经胆汁排出量达 70%, 一般肾功能减退对本品的血浓度、血清半衰期、肾排泄量影响不大, 但肝功能障碍时半衰期延长 2 倍多, 如肾功能严重减退或伴有肝功能减退, 血清半衰期延长。抗菌谱与头孢噻肟相仿, 对革兰阳性菌、阴性菌均有作用, 尤其对铜绿假单胞菌的活性强于头孢噻肟等其他第三代头孢菌素(头孢他啶除外); 肠球菌、李斯特菌属、鼠伤寒杆菌、不动杆菌、脆弱类杆菌对本品耐药。对多数 β 内酰胺酶的稳定性相对较差, 有一定的出血倾向。

【适应症和用法】 用于敏感菌所致的呼吸道、尿路、胆道感染, 败血症、手术前后、耳鼻咽喉炎及皮肤软组织感染。对细菌性脑膜炎有较为满意疗效。可用于联合治疗铜绿假单胞菌感染。

一般感染, 成人每次 1 ~ 2g, 每 12h 1 次肌注、静注或静滴; 严重感染, 每次 2 ~ 3g, 每 8h 1 次; 血液透析后应给予 1 次剂量。儿童每日 50 ~ 200mg/kg, 重症感染 300mg/kg, 分 2 ~ 3 次给药。

【临床合理应用】

不良反应: 总发生率 4%, 以皮疹多见, 腹痛、腹泻、嗜酸性粒细胞增多, 轻度中性粒细胞减少, 暂时性 ALT (GPT)、AST (GOT)、ALP、BUN 或 Cr 升高者少见。个别患者出现血小板减少, 凝血酶原时间延长及出血现象。

禁忌证: 对头孢菌素类药物过敏者禁用。

注意事项: ①应用本品时饮酒或接受含乙醇药物者可出现双硫醒样反应; ②个别患者可导致低凝血酶原症而发生出血现象, 可用维生素 K 控制或预防; ③主要经胆道排泄, 易使肠道菌群失调。

【临床评价】 本品治疗呼吸道感染、尿路感染、肝胆系统感染、败血症等的总有效率超过 80%, 对细菌性脑膜炎(致病菌为脑膜炎双球菌、流感嗜血杆菌)也有较好的疗效。本品与氨基糖苷类抗生素或其他抗铜绿假单胞菌的药物联合治疗铜绿假单胞菌感染可获得满意的疗效。国内南京市第一医院用头孢哌酮治疗感染性疾病患者, 有效率为 83%, 细菌清除率为 78%。其中以胆道感染、泌尿道感染、皮肤软组织感染和败血症疗效最佳, 而下呼吸道感染疗效稍逊。浙江比较头孢哌酮与氧氟沙星治疗伤寒的疗效, 在体温开始下降时间和体温降至正常的时间上, 头孢哌酮显著优于氧氟沙星。

【制剂】 粉针剂：0.5g/瓶，1g/瓶，2g/瓶。

头孢匹胺

Cefpiramide

【异名】 头孢吡四唑，头孢吡兰，先福吡兰，泰吡信。

【作用特点】 本品的化学结构、抗菌活性、对 β 内酰胺酶的稳定性及某些药动学特性均与头孢哌酮和头孢磺啉相似。给药后广泛分布于各种体液及组织中，在痰液、支气管分泌物及女性生殖器官中浓度较高。血清半衰期4~5h，24h尿排泄率22.5%，粪排泄0%~36.9%。当肝功能正常而肾功能减退时，非肾（经肝）排泄占重要地位，可维持给药量不变。本品可被多种 β 内酰胺酶徐缓地水解。对脑膜炎球菌、淋球菌、卡他莫拉菌和流感杆菌高度敏感；对铜绿假单胞菌的抗菌活性与头孢哌酮和哌拉西林相似或略优，但逊于头孢他啶；对多数肠杆菌科细菌有效，但不如头孢噻肟、头孢曲松等三代头孢菌素。对空肠弯曲菌、革兰阴性厌氧菌耐药。对葡萄球菌、链球菌、肺炎链球菌等革兰阳性菌敏感，厌氧球菌耐药。

【适应证和用法】 用于敏感菌所致的尿路感染、下呼吸道感染、败血症、骨关节感染、胆道感染及妇科感染。

成人每日1~2g，儿童每日30~80mg/kg，分2~3次静注或静滴；严重感染时，成人可增至每日4~6g，儿童每日150mg/kg。

【临床合理应用】

不良反应：发生率3.6%，主要为皮疹、荨麻疹、瘙痒、发热等过敏反应。偶见转氨酶升高，二重感染及维生素K和维生素B族缺乏症状。

禁忌证：有本品成分所致过敏性休克既往史的患者禁用。

注意事项：①静注时不得将其先溶于注射用水中（因不等渗）；②对头孢菌素和青霉素有过敏史者慎用；③进食不良或全身情况不佳的患者慎用（可出现维生素K缺乏症状）；④用药期间和用药一周以内不宜饮酒，否则可出现颜面潮红、恶心、心动过速、多汗、头痛等症状。

【临床评价】 临床应用于呼吸系统感染、胆道感染、妇产科感染、泌尿道感染、败血症的有效率分别为60%~97.5%、78.4%~97.9%、83.3%~97.3%、60.1%~90%、57.1%，应用于青霉素类、头孢菌素类、氨基糖苷类等抗生素无效的病例，临床有效率亦可达65.3%；总细菌清除率为78.4%。日本一项双盲临床试验结果显示，每日应用本品2g与每日应用头孢美唑4g治疗1436例呼吸系统感染的临床疗效和不良反

应发生率基本相同。

【制剂】 粉针剂：每支含头孢匹胺钠 1.0g，安息香酸钠（安定剂）75mg。

头孢咪唑

Cefpimizole

【作用特点】 给药后向人的痰液、肺组织、胆汁、腹水、子宫及其附件等高度移行，并可渗入脐带血、羊水及胎儿。血清半衰期 1.9h，主要通过肾排泄，约 80% 以原形从尿中排出。本品的抗菌活性稍逊于头孢噻肟或头孢他啶，对铜绿假单胞菌与头孢哌酮和哌拉西林相仿，较头孢他啶弱 2~8 倍；对革兰阳性菌、流感杆菌、肠杆菌科细菌的抗菌活性略逊于头孢噻肟。体外抗菌活性与其他第三代头孢菌素相比并无优越性。

【适应证和用法】 用于各种敏感菌所致的感染，如败血症、呼吸系统感染、泌尿系统感染、肝胆道感染、腹膜炎、女性生殖系统感染。

成人每日 1~2g，重症每日 4g，分 2~3 次静注或静滴。

【临床合理应用】

不良反应：发生率 3.9%，可见嗜酸性粒细胞增高、粒细胞减少、血小板减少、红细胞减少等，以及肝肾功能损害，胃肠道反应，偶见头疼。

禁忌证：对头孢菌素类过敏者禁用。慎用于对青霉素或头孢烯类过敏史者。

【制剂】 粉针剂：0.5g/支，1.0g/支。

头孢唑南

Cefuzonam

【作用特点】 本品组织分布良好，主要以原形从肾脏排出，血清半衰期 1.1h。抗菌谱与其他第三代头孢菌素类似，对多种 β 内酰胺酶稳定，对革兰阳性菌、革兰阴性需氧菌、厌氧菌等均有较好疗效。MRSA 及其他某些耐第三代头孢菌素细菌亦对本品敏感。对大肠杆菌、克雷伯菌、变形杆菌、流感杆菌等具有强大的杀菌作用，对葡萄球菌、链球菌有良好的抗菌力。

【适应证和用法】 用于各种敏感菌所致的严重感染，如呼吸系统感染、泌尿系统感染、腹内感染、复杂妇科感染、皮肤软组织感染等。

成人每日 1~2g，分 2 次；严重感染每日 4g，分 2~4 次。儿童每日 40~80mg/kg，分 3~4 次，静注或静滴。

【临床合理应用】

不良反应：同其他第三代头孢菌素，发生率为 3.1%，主要有皮疹、荨麻疹、瘙痒，偶见轻度消化道反应。罕见维生素 K、维生素 B 族缺乏症，血清转氨酶升高等。

禁忌证：对头孢菌素类过敏者禁用。

注意事项：本品具有甲硫四唑侧链，对于维生素 K 合成障碍及维生素储备不足（如慢性肝脏疾病、营养不良）等患者，须监测凝血酶原时间，并适当补充维生素 K。孕妇及新生儿慎用。

【制剂】 粉针剂：0.25g/支，0.5g/支，1.0g/支。

头孢克肟

Cefixime

【异名】 氨噻肟烯头孢菌素，世福素（世伏素）。

【作用特点】 本品为口服半合成第三代头孢菌素，生物利用度 40%~52%，蛋白结合率 70%，体液和组织液中分布广，血清半衰期为 3~3.7 h，主要以原形自肝（占 60%）和肾脏（占 40%）排泄。对 β 内酰胺酶稳定，抗菌谱广，抗菌活性强，尤其对肠杆菌科细菌优于头孢克洛、头孢氨苄和头孢羟氨苄；流感杆菌、肺炎链球菌、卡他莫拉菌、淋球菌、化脓性链球菌等对本品敏感。金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌、肠球菌、铜绿假单胞菌、不动杆菌属、无色杆菌属、黄杆菌属、梭杆菌属均耐药。

【适应证和用法】 适用于敏感菌所致呼吸道感染、胆道感染、尿路感染、猩红热、中耳炎、鼻旁窦炎等。

成人每日 400mg，分 1~2 次口服；儿童每日 8mg/kg，单次或分 2 次口服。成人治疗单纯性尿路感染 200mg 单剂即可；较重的感染，成人每日 400mg，儿童每日 12mg/kg。肾功能障碍者适当减量。

【临床合理应用】

不良反应：最常见的有恶心、呕吐、腹痛、腹泻等胃肠道反应；其他不良反应有头痛、头晕和皮疹等。

禁忌证：对 β 内酰胺类抗生素过敏、肾功能不全以及全身情况较差者慎用。对本品过敏者禁用，婴幼儿及孕妇忌用。

【临床评价】 本品是第三代口服头孢菌素，清除半衰期长，每日仅需口服 1~2 次。由于本品部分自胆汁中排泄，因而肾功能不全的患者只有当肌酐清除率低于 20ml/min 时才需要调整剂量。国内北京医科大学第一附属医院应用头孢克肟治疗尿路感染患者，治愈率达 90%，总有效率为 96.7%。中山医科大学附属一院治疗尿路感染患者的

总有效率为 96.7%，其中急性肾盂肾炎的治愈率为 100%。

【制剂】 胶囊剂：50mg/粒，100mg/粒，200mg/粒，400mg/粒；颗粒剂：50mg/袋；干糖浆：50mg/包。

头孢特仑酯

Cefteram Pivoxil

【异名】 头孢特仑新戊酰氧甲酯，富山龙，托米伦。

【作用特点】 本品本身几乎没有抗菌活性，口服吸收后在肠道经酯酶水解为具有抗菌活性的头孢特仑，进餐可增加药物吸收。组织分布好，血清蛋白结合率为 75%，血清半衰期 0.9h，主要经肾排泄，排泄率为 30%~33%，少数可经胆汁排泄。抗菌谱广，对 β 内酰胺酶稳定，对肠杆菌科细菌、流感嗜血杆菌等革兰阴性杆菌及链球菌属等革兰阳性菌有高度的抗菌活性，对假单胞菌属，部分不动杆菌属作用弱，对肠球菌、MRSA 及脆弱类杆菌无效。

【适应证和用法】 适用于敏感菌所致的呼吸道、泌尿道、妇产科、耳鼻咽喉、口腔、眼科、皮肤及软组织等多种感染。

成人每日 300~600mg，分 3 次饭后口服，疗程 7~14d；儿童每日 9~18mg/kg，分 3 次服用。

【临床合理应用】

不良反应：发生率为 4.4%，主要有腹泻、胃部不适、皮疹及过敏症状，实验室检查可见转氨酶轻度升高，嗜酸性粒细胞增多。

禁忌证：既往对本品成分和（或）对头孢菌素类抗生素过敏者禁用。

注意事项：有青霉素类和头孢菌素类抗生素过敏史或家族史中有哮喘、麻疹等过敏体质的患者慎用；严重肝肾功能障碍及全身状况差者慎用。

【临床评价】 本品口服应用方便，患者耐受良好，尤其当病原菌为肠杆菌科细菌并对常用抗生素耐药时，本品更有选用指征。临床应用于 2 243 例患者的总有效率为 80.4%，其中呼吸道感染的有效率为 80.7%，尿路感染的有效率为 80.2%，妇科感染的有效率为 91.1%，耳鼻喉科感染的有效率为 65.4%，口腔科感染的有效率为 88.1%；对其他抗菌药物无效的病例亦可达 65.1%。

【制剂】 片剂：50mg/片，100mg/片，250mg/片。

头孢他美酯

Cefetamet Pivoxil

【异名】 头孢美特酯，安塞他美，康迈欣，高保息。

【作用特点】 本品摄入后经肠壁酯酶水解为头孢他美而发挥抗菌作用。口服生物利用度 50%，进食能促进吸收。体内组织体液分布好，血浆蛋白结合率 22% ~ 25%，血清半衰期 2.2 ~ 2.8h；主要经肾脏排泄，排泄率为 45% ~ 51%，对 β 内酰胺酶稳定，抗菌谱与其他第三代头孢菌素相似，对梅毒螺旋体有活性，对肺炎链球菌、化脓性链球菌、淋球菌、流感嗜血杆菌、大肠杆菌、肺炎杆菌、变形杆菌等有较好的抗菌作用，但对耐青霉素肺炎链球菌、葡萄球菌、肠球菌、厌氧菌无活性，对大多数假单胞菌（包括铜绿假单胞菌）、不动杆菌属耐药。

【适应证和用法】 适用于敏感菌所致的呼吸、泌尿、生殖系统感染，及五官科、皮肤软组织感染。

成人每次 250 ~ 500mg，每日 2 次口服；儿童每次 8 ~ 12mg/kg，每日 2 次口服。

【临床合理应用】

不良反应：发生率 3.9% ~ 12.3%，主要为腹泻、恶心、呕吐和上腹不适等胃肠道反应；其次是荨麻疹、红斑、皮疹、湿疹、口疮和紫癜等皮肤反应；实验室检查可见一过性转氨酶轻度升高，嗜酸性粒细胞增多。

禁忌证：对头孢菌素类过敏者禁用；有青霉素类和头孢菌素类抗生素过敏史患者慎用。

【临床评价】 有作者报告本品治疗急性中耳炎、咽炎、肺炎和淋病的总有效率达 100%。

【制剂】 片剂：250mg/片（活性效价为 194mg）；胶囊：125mg/粒。

头孢布烯

Ceftibuten

【异名】 头孢布坦，头孢噻腾，先力腾。

【作用特点】 本品口服吸收好，生物利用度在第三代口服制剂中最高，达 75% ~ 90%。体内组织体液分布好，血浆蛋白结合率 60% ~ 64%，血清半衰期 2 ~ 3h，60% ~ 70% 自尿中排泄。抗菌谱广，对革兰阴性菌包括肠杆菌科细菌及某些革兰阳性菌如 A 组溶血性链球菌、肺炎链球菌有较强的抗菌性，但对铜绿假单胞菌、金黄色葡萄球菌、

表皮葡萄球菌和厌氧菌耐药。对 β 内酰胺酶高度稳定。

【适应证和用法】 用于敏感菌所致的呼吸道、皮肤、胆道、腹腔、尿道等感染及淋球菌感染。

成人每次 400mg，每日 1 次口服；肺炎患者每次 200mg，每 12h 1 次口服。儿童每次 9mg/kg，每日 1 次口服。

【临床合理应用】

不良反应：发生率 5% ~ 10%，主要为消化道症状，偶有皮疹、倦怠、头昏、目眩；少数可见转氨酶升高，嗜酸性粒细胞增多，停药后即恢复正常。

禁忌证：对头孢菌素类过敏者禁用。对肾功能显著不全患者需要透析时给药量需要调节。对孕妇、分娩、哺乳期以及 6 个月以下婴儿的安全性不能肯定。

【临床评价】 该药为第一个每天一次给药的口服第三代头孢菌素，口服吸收好，血药浓度高，尿中浓度高，但临床上不作为第一线用药，通常用于静脉用第三代头孢菌素的序贯治疗。文献报道静脉应用头孢他啶、或头孢曲松、或头孢噻肟等 2 ~ 4 天后，改用头孢布烯 5 ~ 7 天，治疗呼吸道、泌尿道感染，以及败血症等均获得了良好的疗效，治愈率可达 64% ~ 71%，有效率可达 80% ~ 100%。尤其适用于注射不方便的轻、中度感染的门诊、急诊患者，住院感染控制后需要回家治疗的患者，可以加快病床周转，减少患者治疗费用。

【制剂】 胶囊：100mg/粒，200mg/粒，400mg/粒；干混悬剂：7.5g/瓶。

头孢地尼

Cefdinir

【异名】 头孢狄尼，头孢迪尼，全泽复。

【作用特点】 本品口服后生物利用度 > 36%，体内组织体液分布好，血清半衰期 1.7 ~ 1.8h，24h 尿排泄率 26% ~ 33%。对 β 内酰胺酶稳定，对革兰阳性、阴性和厌氧菌有良好的抗菌活性，尤其是甲氧西林敏感的金黄色葡萄球菌、化脓性链球菌、肺炎链球菌、丙酸菌、淋球菌、大肠杆菌、肺炎克雷伯菌、卡他莫拉菌、枸橼酸杆菌、流感嗜血杆菌。对肠球菌、铜绿假单胞菌和其他假单胞菌、不动杆菌属等作用均差。

【适应证和用法】 用于敏感菌所致的皮肤、乳腺、呼吸道、泌尿道、肛周、五官科、妇科及外科等各种感染。

成人每次 100 ~ 200mg，每日 3 次口服。

【临床合理应用】

不良反应：发生率为 3.4%，主要为腹泻、恶心、呕吐等胃肠道反应。

禁忌证：对本品过敏者及有休克病史者禁用。

注意事项：对于维生素 K 合成障碍及维生素储备不足（如慢性肝脏疾病、营养不良）等患者，须监测凝血酶原时间，适当补充维生素 K。

【临床评价】 一项涉及 1 433 例患者的临床试验报道，每次口服 100mg，每月 3 次，对各种感染的有效率分别为：浅表性化脓性疾病 89.2%，外科感染症 90%，急性呼吸道感染 82.8%，慢性呼吸道感染 63.1%，尿路感染 82.8%，妇科感染 88.4%，眼科感染 94.3%，耳鼻喉科感染 75%；细菌学检测显示，本品对 91.9% 革兰阳性菌、91.4% 革兰阴性菌敏感。

【制剂】 胶囊：50mg/粒，100mg/粒；颗粒剂：50mg/袋。

头孢泊肟酯

Cefpodoxime Proxetil

【异名】 头孢丙肟酯，头孢氨噻醚酯，头孢泊肟普昔酯，头孢脂肪丙酰氧乙酯，博拿，施博，维洁信。

【作用特点】 本品口服吸收后经肠道壁酯酶迅速水解成有抗菌活性的头孢泊肟，口服生物利用度 50%，进食可促进吸收。体内组织体液分布好，血清蛋白结合率 18%~23%，血清半衰期 2.4~2.8h，24h 尿排泄率 24%~32%。对革兰阳性和革兰阴性菌具广谱和强大的抗菌活性，如链球菌、肺炎链球菌、流感嗜血杆菌、大肠杆菌、变形杆菌，对产生 β 内酰胺酶菌也有强活性。对过去口服、 β 内酰胺类药物无效的费劳地枸橼酸杆菌、肠杆菌属、沙雷菌属、吡哌阳性变形杆菌均有高活性。对肠球菌、铜绿假单胞菌和其他假单胞菌、不动杆菌属等作用均差。

【适应证和用法】 适用于敏感菌所致的呼吸、皮肤、尿道、五官科感染。

成人每次 100~400mg，每日 2 次口服；儿童每次 10mg/kg，每日 2 次口服，饭后服用。

【临床合理应用】

不良反应：发生率 4.7%~19%，主要为胃部不适、呕吐、腹泻；偶有皮疹、倦怠、头晕、目眩；少数转氨酶轻度升高，嗜酸性粒细胞增多，停药后即恢复。

禁忌证：对本品成分有休克过敏史者禁用。

注意事项：对青霉素和头孢菌素有过敏史，严重肾功能损害，全身营养状况不佳或有家族性过敏症状者慎用。老年人有时会出现维生素 K 缺乏引起的出血倾向。在妊娠

期和小儿用药的安全性尚未确定。

【临床评价】 本品适用于治疗院外革兰阴性菌感染。临床应用于 2 902 例患者的有效率为 78.4%，其中呼吸道感染的有效率为 83.3%，尿路感染的有效率为 73.3%，外科感染的有效率为 87%，耳鼻喉科感染的有效率为 68.8%，浅表性化脓性感染的有效率为 85.4%，妇科感染的有效率为 89.9%；对细菌的清除率为 90.5%。

【制剂】 片剂：100mg/片。

头孢妥仑

Cefditoren Pivoxil

【异名】 头孢地拖戊烯氧甲酯，头孢地妥仑酯，头孢妥仑匹酯，美爱克。

【作用特点】 口服吸收后水解为头孢地妥仑而发挥抗菌作用，生物利用度达 40%~52%，进食可促进吸收。能很好地分布至各种体液和组织中，血清半衰期 1.1~1.17h，24 小时尿排泄率 13%~34%。本品对 β 内酰胺酶稳定，对需氧菌、厌氧菌都具有广谱抗菌作用，对肠杆菌科细菌、流感杆菌、肺炎杆菌、卡他莫拉菌及奈瑟菌属的抗菌活性强于第二代口服头孢菌素，对葡萄球菌有效，但对肠球菌、铜绿假单胞菌和其他假单胞菌属、不动杆菌属作用差。

【适应证和用法】 用于敏感菌所致的各种呼吸道感染、皮肤软组织感染、尿路感染及胆道感染，总有效率 74% 以上。

成人每次 100~200mg，每天 3 次，饭后口服；儿童每次 3mg/kg，每日 3 次，饭后口服。

【临床合理应用】

不良反应：发生率 4.0%，主要为腹泻、恶心、呕吐等胃肠道反应，实验室检查异常发生率低。

禁忌证：对本品成分过敏者禁用。

【临床评价】 临床应用于治疗细菌性肺炎，有效率可达 89.9%，细菌清除率可达 92.3%。治疗泌尿系统感染有效率 96.1%，皮肤软组织感染为 89.8%。

【制剂】 片剂：100mg/片；小儿用颗粒剂：100mg/包。

(2) 第三代头孢菌素的其他常用药物：