

临床药物手册

金盾出版社

140803
临床药物手册

主 编
龙 焜
主 审
张紫洞

编 者

(以姓氏笔画为序)

龙 焜	孙笃新	李万玄
芮耀诚	宋文萍	陈新生
郑钦岳	姜远英	钱定华

审 校

(以姓氏笔画为序)

仇士杰 张奕栋 张紫洞 杨济秋



A0046507

金盾出版社



目 录

第 1 章 抗生素

一、青霉素类

青霉素钾(1) 普鲁卡因青霉素(3) 苄星青霉素(4) 苯唑青霉素钠(4) 乙氧萘青霉素钠(5) 邻氯青霉素钠(6) 双氯青霉素钠(6) 氨苄青霉素(7) 附:氯唑青霉素钠(8) 羟氨苄青霉素(8) 匹氨青霉素(9) 羧苄青霉素钠(9) 磺苄青霉素钠(10) 呋苄青霉素钠(11) 羧噻吩青霉素钠(11) 氧哌嗪青霉素钠(12) 氮草脲青霉素(12) 苯咪唑青霉素钠(13) 蔡啶青霉素钠(13)

二、头孢菌素类

头孢噻吩钠(14) 头孢噻啶(16) 头孢氨苄(17) 头孢唑啉钠(17) 头孢拉定(18) 头孢克罗(18) 头孢孟多(19) 头孢呋新钠(20) 头孢西丁钠(21) 头孢噻肟钠(22) 头孢哌酮钠(23) 头孢他定(23) 头孢三嗪钠(24) 羧羧氧酰胺菌素钠(25) 头孢乙腈钠(26) 头孢匹林钠(26) 头孢硫脒(26) 头孢羟氨苄(27) 头孢替安(27) 头孢美唑钠(28) 头孢唑肟钠(28) 头孢匹胺(28) 头孢磺啶钠(29)

三、氨基糖甙类

硫酸链霉素(30) 硫酸卡那霉素(32) 硫酸庆大霉素(33) 硫酸丁胺卡那霉素(34) 硫酸妥布霉素(35) 硫酸地贝卡星(36) 硫酸西梭霉素(36) 硫酸乙基西梭霉素(36) 硫酸核糖霉素(37) 硫酸阿司米星(37) 硫酸沙加霉素(37) 硫酸

第 1 章 抗 生 素

抗生素是某些微生物生长过程中产生的代谢物,在低浓度时能破坏或抑制其他微生物生长。目前抗生素的生产可用培养方法,有的可用化学合成或半合成的方法。

自从 1940 年青霉素开始应用于临床以来,发现和发明的抗生素已达几千种,但临床常用的不过百种左右。本章介绍的是对大多数革兰氏阴性菌或阳性菌有显著抗菌活性的抗生素。其它一些抗生素如抗真菌抗生素、抗结核病抗生素及抗肿瘤抗生素等将在有关章节中介绍。

抗生素是治疗感染性疾病的特效药物,应用十分广泛,它们的最大特点是抗菌作用强、起效快、疗效好;但有些抗生素亦存在毒性大、过敏反应重、细菌易产生耐药性或导致二重感染等问题。应用时必须严格掌握适应证,合理使用,切勿滥用。

一、青霉素类

青霉素钾(苄青霉素钾,青霉素 G 钾,盘尼西林钾)

Benzylpenicillin Potassium

(Penicillin G Potassium, Penicillin)

【性状】 临床上常用的是钾盐,亦有钠盐。钾盐每 g 含钾 2.7mmol (2.7mEq),钠盐每 g 含 2.8mmol (2.8mEq)。为白色结晶性粉末,有吸湿性,易溶于水。10%的水溶液 pH 为 5.5~7.5。钾盐的 5.48%溶液与血清等渗。钾盐或钠盐含水低于 0.5%并密封,室温保存 2~3 年效力稳定。无缓冲剂的注射液,室温接近 20℃条件下应在 24 小时内使用;贮存在 2~10℃应在 7 天内使用。遇金属离子如铜、锌、汞等及氧化剂、还原剂时可失活。

注,否则可因血钾突然升高而产生心脏抑制。

【药物相互作用】 ①丙磺舒可竞争性抑制青霉素在肾小管的分泌排泄,延长其 $t_{1/2}$,有利于增加青霉素的治疗血浓度。水杨酸、消炎痛和苯磺唑酮亦有类似作用。②氯霉素、红霉素、四环素等抑菌抗生素可能干扰青霉素的杀菌作用,但这种相互作用仅发生在特定剂量条件下,如氯霉素血浓度较低($0.1\sim 5\mu\text{g/ml}$)时可减弱青霉素的作用,当血浓度较高($10\mu\text{g/ml}$)时则无此作用。③头孢噻吩钠、安泰乐、盐酸林可霉素、重酒石酸间羟胺、重酒石酸去甲肾上腺素、苯妥英钠、马来酸甲哌氯丙嗪、盐酸异丙嗪、盐酸四环素、盐酸万古霉素等与青霉素混合静滴可产生混浊。

【用法与剂量】 一般感染以肌注给药为宜。成人 80 万 $\sim$ 240 万 U/日,分 2 $\sim$ 3 次注射;重症感染可加大剂量,并可用静滴给药。静滴宜用钠盐,以生理盐水或 5% $\sim$ 10%葡萄糖液溶解成 1 万 U/ml 后滴注。钾盐也可静滴,但必须注意钾的含量。每 100 万 U 中含钾量为 65mg,相当于氯化钾 125mg 中的含钾量。治疗梅毒时,为避免赫氏反应,首剂以 5 万 U 为宜。儿童每日 5 万 $\sim$ 25 万 U/kg,分次肌注或静滴。

鞘内注射适用于肺炎球菌性脑膜炎。成人 5000 $\sim$ 10000 U/次,儿童 2500 $\sim$ 5000 U/次。以生理盐水溶解成 1000 $\sim$ 2000 U/ml 后使用。

【制剂】 粉针剂:20 万 U,40 万 U,80 万 U,100 万 U。

普鲁卡因青霉素(普青)

Procaine Benzylpenicillin

(Procaine Penicillin G, Duracillin)

【性状】 白色结晶性粉末,无臭。微溶于水(1:200),可溶于乙醇(1:30)、氯仿(1:60)。30%的混悬水溶液 pH 5 $\sim$ 7.5。本品 300 mg 约与 200 mg 青霉素(30 万 U)等效。

【作用与用途】 与青霉素基本类似。因在水中溶解度小,肌注后吸收缓慢,维持血浓度时间较长,1 次注射可维持 12 $\sim$ 24 小时。但血浓度比等效剂量的青霉素低,只适用于轻度或中度感染。

【不良反应与注意事项】 与青霉素相似。对青霉素或普鲁卡因过

敏者不宜使用。婴儿对局部反应较敏感,需小心应用,新生儿最好不用。

【用法与剂量】 仅供肌肉注射。成人 40 万~80 万 U/次,1~2 次/日;6 个月~4 岁儿童 20 万~40 万 U/次;5~12 岁儿童剂量同成人。以注射用水配制成混悬液后使用。

【制剂】 粉针剂:40 万 U,80 万 U。

苄星青霉素(苄星青,比西林,长效西林)

Benzathine Benzylpenicillin

(Benzathine Penicillin, Benzethacil, Dibenzyl Penicillin)

【性状】 白色、无臭、几乎无味、有吸湿性的粉末。极微溶于水(1:6000)。可溶于乙醇(1:65)。饱和水溶液的 pH 5~7.5。本品 900mg 近似与 720mg 青霉素(120 万 U)等效。

【作用与用途】 与青霉素基本相同。因水中溶解度极小,肌注后贮存于局部缓慢释出青霉素,吸收。血浓度较低,但维持时间长。单次剂量 120 万 U 肌注后,有效血浓度达 4 周。适用于敏感细菌引起的轻、中度感染。亦可用于风湿热的预防性给药。不适用于急性严重感染。

【不良反应与注意事项】 与青霉素相似。

【用法与剂量】 仅供深部肌肉注射。成人 120 万 U/次,每月 1 次,或 60 万 U,每半月 1 次。儿童剂量酌减。以注射用水配制成混悬液后应用。

【制剂】 粉针剂:60 万 U,120 万 U。

苯唑青霉素钠(苯唑西林钠,苯甲异噁

唑青霉素钠,新青霉素Ⅱ钠)

Oxacillin Sodium(Bactocill, Prostaphlin)

【性状】 白色结晶性粉末,无臭或微臭,味苦。每 g 含钠 2.3 mmol (2.3mEq)。可溶于水(1:3.5)、乙醇(1:90),微溶于无水乙醇、氯仿,不溶于丙酮、乙醚、乙酸乙酯等。3%水溶液 pH 4.5~7.5。

【作用与用途】 抗菌作用方式同青霉素,特点是耐青霉素酶,对耐青霉素的葡萄球菌有效,但对青霉素敏感的葡萄球菌和链球菌等的作

用较青霉素弱得多。本品在胃酸中稳定,故口服有效,口服后1小时达峰血浆浓度,血浆蛋白结合率93%。临床主要用于耐青霉素的葡萄球菌感染。亦可用于耐青霉素葡萄球菌与链球菌或肺炎球菌引起的混合感染。

【不良反应与注意事项】 与青霉素相似。另有报告,本品静脉给药治疗偶有转氨酶升高和中性粒细胞减少。婴儿大剂量应用后可出现血尿、蛋白尿。对青霉素过敏病人忌用,新生儿和肝功能障碍病人慎用。

【用法与剂量】 口服:成人0.5~1.0g,每4~6小时1次;儿童50~100mg/kg/日,分剂量每4~6小时1次。肌注:0.25~1.0g,每4~6小时1次。静脉给药:以肌注相同剂量,以5~10ml注射用水或生理盐水溶解后缓慢静脉注射;亦可用静滴给药。

食物可减少本品从胃肠吸收,口服治疗时最好在餐前1~2小时服用。

【制剂】 粉针剂:0.5g。胶囊:0.25g。

乙氧萘青霉素钠(萘夫西林钠,新青霉素Ⅱ钠)

Nafcillin Sodium(Nafcil, Unipen)

【性状】 白色或类白色粉末。每g含钠2.2mmol(2.2mEq)。易溶于水,可溶于乙醇。3%水溶液pH5~7。

【作用与用途】 与苯唑青霉素相似,具有耐青霉素酶和在胃酸中稳定的特点,可口服。主要用于耐青霉素的金葡菌感染及耐药金葡菌与链球菌或肺炎球菌的混合感染。

【不良反应与注意事项】 同青霉素。静脉注射可能发生静脉炎,特别是在老年患者。肌注给药有时可能有转氨酶升高。对青霉素过敏者忌用。

【用法与剂量】 肌注:成人500mg,每4~6小时1次;儿童25mg/kg,2次/日。口服:成人0.25~1.0g,每4~6小时1次;儿童6.25~12.5mg/kg,4次/日;新生儿10mg/kg,3~4次/日。餐前1~2小时服用。

【制剂】 粉针剂:0.5g。胶囊剂:0.25g。

**邻氯青霉素钠(氯唑西林钠,氯唑青霉素钠,
邻氯苯甲异噁唑青霉素钠)**

Cloxacillin Sodium (Clocillin, Novocloxin, BRL-1621)

【性状】 白色结晶性粉末,无臭,味苦,有吸湿性。每 g 含钠量约 2.1mmol(2.1mEq)。可溶于水(1:2.5)、乙醇(1:30),微溶于氯仿(1:500)。10%水溶液 pH 5~7。

【作用与用途】 抗菌作用与苯唑青霉素类似,是耐青霉素酶又耐酸的青霉素。对耐青霉素的葡萄球菌及大多数革兰氏阳性菌有效。口服吸收好,血浆峰浓度较苯唑青霉素高,血浆蛋白结合率 94%。主要用于对青霉素耐药的葡萄球菌感染及耐药金葡菌与链球菌或肺炎球菌的混合感染。

【不良反应与注意事项】 与青霉素相似。对青霉素过敏者不宜使用。

【用法与剂量】 可以口服、肌注或静脉给药。成人剂量 500mg/次,每 4~6 小时 1 次;对严重感染剂量可加倍。因食物可减少吸收,口服制剂宜空腹时使用。肌注或静脉给药剂量与口服剂量相同。静脉给药可将药物溶于 10~20ml 生理盐水中缓慢推注,或溶于 100~200ml 生理盐水中静滴。

儿童剂量 2 岁以下用成人剂量的 1/4,2~10 岁用成人剂量的 1/2。

【制剂】 粉针剂:0.5g,1.0g。胶囊剂:0.25g。

双氯青霉素钠(双氯西林钠,双氯苯甲异噁唑青霉素钠)

Dicloxacillin Sodium (Diclocillin, Diclocil, BRL-1702)

【性状】 白色结晶性粉末,有苦味。每 g 含钠 2mmol(2mEq)。易溶于水,可溶于甲醇,不溶于醚。1%水溶液 pH4.5~7.5。

【作用与用途】 抗菌作用与氯唑青霉素相似而较强。本品被认为是对耐青霉素的金葡菌作用最强的半合成青霉素。对胃酸稳定,口服吸收较苯唑青霉素和氯唑青霉素更好,血浓度较高。但血浆蛋白结合率高达 97%。用途同氯唑青霉素。

【不良反应与注意事项】 与青霉素相似。偶见血清转氨酶升高。对青霉素过敏者不宜使用。

【用法与剂量】 口服：成人 0.25~0.5g，每 4~6 小时 1 次。对严重感染剂量可加倍。餐前 1 小时服。儿童 12~100mg/kg/日，分 4 次服。

【制剂】 片剂：0.25g。

氨苄青霉素(氨苄青,氨苄西林)

Ampicillin (Ampicil, Aminobenzylpenicillin)

【性状】 白色结晶性粉末，无臭，味苦。可溶于水(1:170)，几乎不溶于乙醇、丙酮、氯仿、乙醚等。用作注射剂的钠盐可溶于水(1:2)、丙酮(1:50)，微溶于氯仿，几乎不溶于乙醚。钠盐的 10% 水溶液 pH 8~10。

【作用与用途】 抗菌作用方式同青霉素，但抗菌谱较广，对革兰氏阳性菌和阴性菌都有效，对肠球菌的作用优于青霉素。对革兰氏阴性菌的作用与氯霉素、四环素相似，特别是流感杆菌、伤寒杆菌和大肠杆菌的大多数菌株都较敏感。淋球菌、脑膜炎球菌、变形杆菌、布氏杆菌、痢疾杆菌亦较敏感。但对绿脓杆菌无效。本品不耐青霉素酶，对耐药的金葡菌、变形杆菌、大肠杆菌无效。痢疾杆菌、伤寒杆菌、B 组嗜血流感杆菌对本品的耐药性亦已有报告。

本品主要用于敏感菌引起的感染，对呼吸道感染尤其是嗜血性流感杆菌肺炎和支气管炎特别有效。用于敏感菌引起的肺炎、儿童脑膜炎、尿路感染、胆道感染、败血症和伤寒、肠球菌心内膜炎等均获得良好疗效。亦可用于淋病，但疗效不及普鲁卡因青霉素和四环素。

【体内过程】 本品对胃酸较稳定，口服吸收好，但食物可影响吸收。口服后 2 小时达峰血浆浓度。体内清除较青霉素慢， $t_{1/2}$ 1~2 小时。尿和胆汁中浓度较高。

【不良反应与注意事项】 与青霉素相似。斑状丘疹是本品过敏反应的特征，而青霉素是以荨麻疹为特征。口服有恶心、呕吐和腹泻等反应。少数病人有血清转氨酶升高、假膜性结肠炎、假单胞菌和念珠菌二重感染发生。对青霉素过敏者忌用。有感染性单核白细胞增多的病人不宜使用，因为它们对本品诱导的皮疹特别敏感。肾功能损伤病人应减少

作用弱于青霉素；对大肠杆菌、沙门氏菌、志贺氏菌、嗜血流感杆菌和奈瑟氏菌等革兰氏阴性菌作用略逊于氨苄青霉素。其特点是对吲哚阳性变形杆菌和绿脓杆菌有效。但本品不耐青霉素酶，绿脓杆菌对本品可产生耐药性。

主要用于绿脓杆菌感染，亦可用于变形杆菌和大肠杆菌感染的治疗，如绿脓杆菌败血症、肺部感染、尿路感染、脑膜炎、乳突炎、骨髓炎等。本品与庆大霉素、妥布霉素或丁胺卡那霉素合用，对绿脓杆菌或其它革兰氏阴性杆菌感染有协同作用。

【体内过程】 本品口服不吸收。肌注 1g 后 1 小时达峰血浆浓度 30 μ g/ml。50% 与血浆蛋白结合，消除 $t_{1/2}$ 为 1 小时；剂量的 80% 以原形药出现在尿中，6 小时内尿中浓度 2~4mg/ml。

【不良反应与注意事项】 与青霉素相似。可影响血小板功能或凝血机制而引起紫癜和出血，肾损伤病人应用大剂量可发生抽搐等神经系统反应。大剂量应用可能引起电解质失衡。对青霉素过敏的患者忌用，有过敏史或肾功损伤患者要慎用。

【药物相互作用】 ①与丙磺舒合用可提高本品血浓度。②与庆大霉素、妥布霉素或丁胺卡那霉素合用可产生协同作用，但不要在同一注射器或输液瓶内混合使用，否则后三者效力降低。③本品与下列药物有配伍禁忌：两性霉素、氯霉素琥珀酸钠、红霉素琥珀酸乙酯、硫酸卡那霉素、盐酸土霉素、硫酸链霉素、盐酸四环素、B 族维生素和维生素 C 等。

【用法与剂量】 肌注：成人一般敏感菌感染，4~8g/日，分 3~4 次给；儿童 50~100mg/kg/日，分 3~4 次给。缓慢静注或快速静滴：用于严重全身性感染，成人 2~5g/次，3~4 次/日；儿童 100~400mg/kg/日，分 3~4 次给。

【制剂】 粉针剂：0.5g, 1.0g, 2.0g, 5.0g。

磺苄青霉素钠(磺苄西林)

Sulbenicillin Sodium (Sulfocillin, Kedacillin)

【性状】 白色至黄色结晶性粉末，每 g 含钠 4.4mmol (4.4mEq)。易溶于水，略溶于乙醇，难溶于丙酮和氯仿。

【作用与用途】 抗菌作用和用途与羧苄青霉素相似。对耐药金葡

菌和某些绿脓杆菌菌株作用稍强。主要用于绿脓杆菌和大肠杆菌所致的感染。

【不良反应与注意事项】 与羧苄青霉素相似。

【用法与剂量】 静注：成人 1~2g/次，2~4 次/日，或 4~8g/日，静滴。儿童每日 40~80 mg/kg，最大可达 180 mg/kg/日。

【制剂】 粉针剂：0.5g、1.0g。

呋苄青霉素钠(呋苄西林,呋脲苄青霉素)

Furbenicillin Sodium(BL-P1597)

【性状】 白色结晶性粉末，易溶于水。

【作用与用途】 本品对绿脓杆菌作用较强，体外试验的抑菌作用比羧苄青霉素强 4~16 倍，对感染动物的保护作用则强 2~3 倍。主要用于绿脓杆菌感染，在其它抗生素无效时改用本品往往可在奏效。也可用于大肠杆菌或其他敏感菌的感染性疾病。

【不良反应与注意事项】 有消化道反应，口周、面部和四肢皮肤发麻，严重时有肌颤。与青霉素有交叉过敏反应，对青霉素过敏者忌用。

【用法与剂量】 静滴：成人 1~2g/次，加入 5%葡萄糖液 50~100ml 中，在 0.5~1 小时内滴完，4 次/日。严重感染可用 8g/日。儿童 0.1~0.15g/kg/日，用法同上。

【制剂】 粉针剂：0.5g。

羧噻吩青霉素钠(替卡西林)

Ticarcillin Sodium(Ticarcillin,BRL-2288)

【性状】 白色至乳黄色粉末，有吸湿性。每 g 含钠 4.7mmol(4.7 mEq)。易溶于水，1%水溶液的 pH 为 6~8。

【作用与用途】 抗菌谱与羧苄青霉素相似。但对绿脓杆菌的活性比羧苄青霉素强 2~4 倍，同羧苄青霉素一样，本品不耐青霉素酶，某些绿脓杆菌菌株可较快产生耐药性，而且这两种抗生素间常发生交叉耐药性。其抗菌作用亦可被庆大霉素或妥布霉素增强。临床主要用于严重的革兰氏阴性菌感染，特别是绿脓杆菌感染。

科细菌的作用强于氨苄青霉素。对氨苄青霉素耐药的大肠杆菌和克雷白氏菌亦很敏感。对革兰氏阳性菌作用较差。绿脓杆菌、吲哚阳性变形杆菌、嗜血性流感杆菌、粪链球菌对本品耐药。本品虽也抑制细胞壁合成,但作用方式与青霉素不同,故与青霉素类或头孢菌素类合用,对革兰氏阴性菌有协同作用,但与氨基糖甙类抗生素无协同作用。

本品广泛用于尿路感染,对大肠杆菌感染(包括耐氨苄青霉素菌株)疗效甚好。对肺炎杆菌、肠杆菌等所致感染亦有相当疗效。对伤寒、副伤寒疗效亦较好。

【不良反应与注意事项】 过敏可能发生。对青霉素或头孢菌素过敏的病人忌用,有其他过敏史患者慎用。肾功能减退者需减少剂量。

【用法与剂量】 肌注、静注或静滴:5mg/kg,每6~8小时1次,对严重感染可用10mg/kg,每6小时1次。

【制剂】 粉针剂:200mg,400mg。

苯咪唑青霉素钠(阿洛西林) **Azlocillin Sodium(Securopen)**

本品为白色或灰黄色结晶性粉末,每g含钠量2.1mmol(2.1mEq)。抗菌谱与羧苄青霉素相似,而抗菌活性,特别是抗绿脓杆菌的活性比羧苄青霉素强8倍。口服吸收差,需注射给药。临床主要用于治疗绿脓杆菌感染。不良反应与注意事项同青霉素。常用剂量2~5g/次,每8小时1次。肾肌酐清除率低于每分钟30ml的患者,每12小时给药1次。剂量2g/次或更小量时,以注射用水溶解成10%溶液静脉推注,剂量较大时应以20~30分钟内静滴给药。儿童剂量:1~2岁,0.5g;2~6岁,0.5~1g;6岁以上1~3g;每8小时1次。3kg以上婴儿,50mg/kg,8小时1次;3kg以下及早产儿50mg/kg,12小时1次。

萘啶青霉素钠(阿帕西林) **Apalcillin Sodium(Lumota,PC-904)**

本品抗菌谱较氨苄和羧苄青霉素广。对革兰氏阳性菌(包括厌氧球菌和杆菌)、革兰氏阴性菌均有较高活性。在体内比较研究,对绿脓杆菌

引起的小鼠感染,本品作用比羧苄青霉素强 7~10 倍,对高毒力菌株也强 4~7 倍;对大肠杆菌强 2~15 倍;对肺炎杆菌强 8 倍;对溶血性链球菌强 2 倍。可用于敏感的革兰氏阳性或阴性菌感染,如呼吸道感染、尿路感染、胆道感染、妇科和手术感染、眼耳鼻喉科感染等均获得较好疗效。不良反应有皮疹、发热、头痛、腹泻、恶心,少数病人有血清转氨酶升高。

剂量:1~2g/日,最高 4g/日。肌注、静注或静滴给药。

二、头孢菌素类

头孢菌素类是半合成抗生素。抗菌谱广,作用强,耐青霉素酶,疗效高,毒性低,过敏反应比青霉素类少为其特点。其中第一代头孢菌素虽对青霉素酶稳定,但可被革兰氏阴性菌产生的 β -内酰胺酶破坏,故主要用于耐青霉素金葡菌及某些革兰氏阴性菌感染。第二代头孢菌素对 β -内酰胺酶稳定,而且抗菌谱较第一代广,对革兰氏阴性菌的作用亦较强,但对某些肠杆菌科细菌和绿脓杆菌等的抗菌活性仍较差。第三代头孢菌素对 β -内酰胺酶稳定,对革兰氏阴性菌的作用更强,对绿脓杆菌有较强作用。目前作用更好、具有不同特点的新头孢菌素还在不断出现。头孢菌素在治疗感染性疾病中的作用正日益受到重视,但由于成本较高,价格昂贵,应用尚受到一定限制。

第一代头孢菌素有头孢噻吩、头孢噻啶、头孢氨苄、头孢唑啉、头孢拉啶、头孢乙腈、头孢匹林、头孢硫脒、头孢羟氨苄、头孢克罗等。

第二代头孢菌素有头孢孟多、头孢呋新、头孢替安、头孢美唑等。

第三代头孢菌素有头孢塞肟、头孢哌酮、头孢他定、头孢三嗪、头孢唑肟、头孢甲肟等。

头孢菌素的衍生物头孢西丁和羧基氧酰胺菌素作用与头孢菌素相似,前者属第二代,后者属第三代。

头孢噻吩钠(先锋霉素 I)

Cefalothin Sodium (Cephalothin, Cefalotin)

【性状】 白色结晶性粉末,几乎无臭、味苦。每 g 含钠 2.39mmol

【不良反应与注意事项】 副作用与头孢噻吩相似,但静脉给药所致静脉炎和肌注疼痛较少。肾衰病人应减量使用。

【用法与剂量】 肌注或静注:成人 500mg/次,每 12 小时 1 次。必要时 0.5~1g/次,每 6 小时 1 次。1 月以上儿童 25~50mg/kg/日,分 2~4 次用。严重感染时最大剂量 100mg/kg/日。

无尿病人给负荷剂量 500mg 后,每 24 小时 200mg;肌酐清除率低于 20ml/分者,每 24 小时给予 75~400mg;肌酐清除率低于 40ml/分和 70ml/分者,每 12 小时分别给予 125~600mg 和 0.25~1.25g。

【制剂】 粉针剂:0.5g,1g。

头孢拉定(先锋霉素 VI,环己烯胺头孢菌素,头孢雷定) Cefradine(Cephadrine, Velosef)

【性状】 白色至乳白色结晶性粉末,有特异臭。可溶于水中(1:50),pH 在酸性或中性时溶解很小。可溶于甲醇(1:20)。易溶于丙二醇,略溶于丙酮,难溶于乙醇、氯仿和醚。1%的水溶液 pH 约 3.5~6。

【作用与用途】 抗菌作用类似于头孢氨苄。口服吸收好,血浓度较高,但食物可延缓吸收。主要以原形经尿排泄,尿中浓度亦较高, $t_{1/2}$ 约 50 分钟。可口服或注射给药,治疗敏感菌引起的感染。对呼吸道、泌尿道、肠道及软组织感染如支气管炎、肺炎、肾盂肾炎、膀胱炎、猩红热、肠炎、痢疾等疗效较好。

【不良反应与注意事项】 与头孢氨苄基本相似。本品肌注有疼痛,静注后可发生静脉炎。肾功能损伤患者应减小剂量。

【用法与剂量】 口服、肌注或静注:成人 250~500mg/次,4 次/日。严重感染时可使用 4g/日。儿童口服 25~50mg/kg/日,严重感染可注射 50~100mg/kg/日。

【制剂】 胶囊剂:0.25g,0.5g。粉针剂:0.5g(含碳酸钠)。

头孢克罗(头孢氯氨苄) Cefaclor(Ceclor)

【性状】 白色结晶性粉末,溶于水(1:100),极微溶于氯仿、乙醚

和甲醇。2.5%水溶液 pH 为 3.0~4.5

【作用与用途】 抗菌作用与头孢氨苄基本相似;但对革兰氏阴性菌包括大肠杆菌、克雷白氏肺炎杆菌、奇异变形杆菌,特别是嗜血流感杆菌和奈氏淋球菌的作用更强。对金葡菌青霉素酶的耐受力较头孢氨苄或头孢拉定差。主要用于敏感菌引起的感染,如肺炎、支气管炎、咽喉炎、扁桃体炎、中耳炎、皮肤软组织感染、肾盂肾炎、膀胱炎等。

【体内过程】 口服吸收较好,但血浓度较同剂量的头孢氨苄或头孢拉定稍低,服后 1 小时达峰浓度,消除 $t_{1/2}$ 为 0.5~1 小时。

【不良反应与注意事项】 与头孢氨苄相似。

【用法与剂量】 口服:成人 250~500mg,每 8 小时 1 次,最大可达 4g/日;儿童 20~40mg/kg/日。肾功能中度和重度损伤患者剂量分别减至正常剂量的 1/2 和 1/4。

【制剂】 胶囊剂:0.25g。

头孢孟多(头孢羟唑)

Cefamandole Nafate(Mandol, Cefadol, Kefadol)

【性状】 本品制剂为头孢孟多钠甲酸酯的结晶状粉末,1.11g 头孢孟多钠甲酸酯相当于 1g 头孢孟多,并在注射剂中加入碳酸钠 63mg,共含钠 3.3mmol(3.3mEq)。极易溶于水,难溶于大多数有机溶剂。10%水溶液 pH 为 3.5~7.0。

【作用与用途】 本品为第二代头孢菌素,抗菌谱比第一代更广。同头孢噻吩、头孢噻啶比较,本品对革兰氏阳性球菌的活性相似,但对青霉素酶更稳定,又耐革兰氏阴性菌产生的 β -内酰胺酶,对肠杆菌、肺炎杆菌、吲哚阳性变形杆菌和嗜血性流感杆菌等革兰氏阴性菌的作用亦较强。对绿脓杆菌无效。

临床可用于敏感菌引起的感染,包括肺炎、支气管炎、脓胸、肺脓肿、尿路感染、皮肤软组织感染、败血症、化脓性脑膜炎、腹膜炎、盆腔炎以及厌氧菌(拟杆菌、消化球菌、消化链球菌、梭状杆菌等)感染。

【体内过程】 口服吸收差,注射给药后头孢孟多钠甲酸酯在体内迅速水解释放出头孢孟多。可分布于全身各组织体液,包括脑脊液、骨髓和关节液中。主要以原形从尿中排泄,胆汁中亦有少量排泄。血浆 $t_{1/2}$

10ml/分,0.75g/次,1次/日。

【制剂】 粉针剂:0.25g,0.75g,1.5g。

头孢西丁钠(头霉素甲氧噻吩钠)

Cefoxitin Sodium(Mefoxin,Mefoxitin)

【性状】 本品为头霉素 C(Cephameycin C)的衍生物。其基本结构与头孢菌素相同,主要差别是在 7 β -氨基头孢烷酸核上接上一个 7 α -甲氧基。其钠盐为白色粉末,有吸湿性,有轻微特异臭。每 g 含钠 2.23 mmol(2.23mEq)。极易溶于水,略溶于乙醇,微溶于丙酮,难溶于氯仿和乙醚。10%水溶液 pH 4.2~7.0。

【作用与用途】 抗菌谱同第二代头孢菌素的头孢孟多和头孢呋新相似,对 β -内酰胺酶稳定。但对吲哚阳性变形杆菌作用更强,而对嗜血流感杆菌、金葡菌和肠杆菌作用较弱,对脆弱拟杆菌亦有效。绿脓杆菌和大多数肠球菌耐药。可用于敏感菌感染的治疗。

【体内过程】 口服难吸收,需注射给药,大部分以原形排泄,尿中浓度高。 $t_{1/2}$ 约 45~60 分钟。

【不良反应与注意事项】 副作用同头孢噻吩相似。与其他 β -内酰胺抗生素有部分交叉过敏反应。对头孢菌素过敏的病人不宜使用。对青霉素过敏或有其他药物过敏史的病人应该慎用。肾功能损伤病人应减量使用。

【用法与剂量】 肌注或静注:成人 1~2g,每 8 小时 1 次。严重感染可适当加大剂量。2 岁以上儿童 80~160mg/kg/日,严重感染可增至 200mg/kg/日。

肾功能损伤病人按肌酐清除率调整剂量。给予负荷剂量 1~2g 后,肌酐清除率 30~50ml/分,每 8~12 小时给予 1~2g;肌酐清除率 10~29ml/分,每 12~24 小时给予 1~2g;肌酐清除率 5~9ml/分,每 12~24 小时给予 0.5~1g;肌酐清除率小于 5ml/分,每 24~48 小时给予 0.5~1g。

【制剂】 粉针剂:1g,2g。

【制剂】 粉针剂:0.5g,1g,2g。

头孢哌酮钠(先锋必,头孢氧哌唑)

Cefoperazone Sodium (Cefobid)

【性状】 白色结晶性粉末,极易溶于水,25%水溶液 pH 为 5.0~6.5。

【作用与用途】 本品抗菌谱和抗菌活性基本与头孢噻肟相似。但对绿脓杆菌的作用较头孢噻肟强,与氧哌嗪青霉素相仿。主要用于各种敏感菌引起的感染,特别是绿脓杆菌感染。

【体内过程】 口服吸收差,肌注后 1 小时达峰血浆浓度。可分布至全身组织和体液中。由尿和胆汁中排泄,尿和胆汁中浓度较高。消除 $t_{1/2}$ 约 2 小时左右。

【不良反应与注意事项】 与头孢噻肟相似,而毒性低微,不良反应少见。

【用法与剂量】 肌注、静注或静滴:成人 1~2g/次,每 12 小时 1 次,病情严重者可增至 8g/日。儿童 50~200mg/kg/日,分 2 次给药。肌注时将药物溶于 3~4ml 注射用水中使用;静注时将药物溶于 20ml 5%葡萄糖液或生理盐水中,于 3~5 分钟注入;静滴时,将药物溶于 250~500 葡萄糖液中,于 1~2 小时滴完。单纯性淋病 500mg 单剂量肌注。

本品使用时,溶液需新鲜配制,若分次注射,则水溶液需置冰箱中保存,且不得超过 24 小时。

【制剂】 粉针剂:0.5g,1g,2g。

头孢他定(头孢噻甲羧肟,复达欣)

Ceftazidime (Fortum)

【性状】 本品为白色或微黄色粉末。注射制剂中每 g 添加 118mg 碳酸钠,加入注射用水后泡腾溶解成澄明溶液。

【作用与用途】 与头孢噻肟相似,对大多数革兰氏阳性和阴性菌有杀菌作用,耐青霉素酶和 β -内酰胺酶。其最大特点是对绿脓杆菌的活