第 1 章　抗感染类药物

第一节　抗生素类药物

一、青霉素类

青　霉　素
Benzylpenicillin

【别名】苄青霉素,青霉素钠,青霉素钾,盘尼西林,青霉素 G,Penicillin G,Tabillin

【化学名称】 (2S,5R,6R)-3,3-二甲基-6-(2-苯乙酰氨基)-7-氧代-4-硫杂-1-氮杂双环[3,2,0]庚烷-2-甲酸

【化学分子式】 $C_{16}H_{18}N_2O_4S$

【剂型、性状】注射用青霉素钠：每瓶 0.24g(40 万 U),0.48g(80 万 U)或 0.6g(100 万 U) 注射用青霉素钾 每支 0.25g(40 万 U)。白色结晶性粉末,无臭或微有特臭,有吸湿性。遇酸、碱及氧化剂等迅速失效，其水溶液置室温易失效，极易溶于水,溶于乙醇,不溶于脂肪油或液体石蜡。常用其钠、钾盐,青霉素钠 0.6μg 为 1U,1mg 相当于 1670U。青霉素钾 0.625μg 为 1U,1mg 相当于 1598U。

【药理作用】本品抑制繁殖期细菌细胞壁合成,为快速杀菌药,对革兰阳性球菌(链球菌、肺炎球菌、敏感的葡萄球菌)及革兰阴性球菌(脑膜炎球菌、淋球菌)的抗菌作用较强,对革兰阳性杆菌(白喉杆菌)、螺旋体(梅毒螺旋体、回归热螺旋体、钩端螺旋体)、梭状芽胞杆菌(破伤风杆菌、气性坏疽杆菌)、放线菌有抗菌作用。

【体内过程】本品不耐酸，口服后吸收差，肌注后 0.5h 血浓度达峰值,约 20U/ml,2～4h 胆汁浓度达峰值。广泛分布于组织、体液中。易透入炎症组织,难透过血-脑脊液屏障。蛋白结合率为 46%～58%，$t_{1/2}$ 约 30min,约 76% 注射量的青霉素于 6h 内经肾排出。

【临床应用】①化脓性链球菌感染，如咽炎、猩红热、蜂窝组织炎、丹毒、肺炎、化脓性关节炎、产褥热及败血症。②脑膜炎双球菌或其他敏感细菌引起的脑膜炎，脑膜炎双球菌引起的散发或流行性脑膜炎。肺炎双球菌、流感杆菌敏感的葡萄球菌等引起的化脓性脑膜炎,可用大剂量青霉素 G 治疗。③梅毒螺旋体引起的梅毒：青霉素仍是治疗各期梅毒的最好药物。④淋病：虽然对青霉素耐药的淋球菌日益增多，但以青霉素治疗淋病仍占重要地位。⑤革兰阳性杆菌引起的感染：破伤风杆菌、白喉杆菌、炭疽杆菌引起的感染,可应用青霉素 G 同时用抗毒素治疗。③用于预防链球菌性咽炎、复发性风湿热。

【用法用量】肌注：成人一日量为 80 万～320 万 U,儿童一日量为 3 万～5 万 U/kg,分 2～4 次给予。静滴 成人一日量 240 万～2000 万 U,儿童一日量 20 万～40 万 U/kg,分 4～6 次加至少量输液中作间歇快速滴注。输液的青霉素浓度一般为 1 万～4 万 U/ml。

【不良反应】①毒性反应：青霉素鞘内注射和全身大剂量应用可引起肌肉痉挛、抽搐、昏迷等神经系统毒性反应。②变态反应：表现为皮疹、药物热、血管神经性水肿、血清病反应、过敏性休克等。③赫氏反应 以青霉素治疗梅毒时可有症状加剧现象,表现为全身不适、寒战、发热、咽痛、肌痛、心跳加快等。赫氏反应也可发生于治疗钩端螺旋体、炭疽等。④二重感染 主要为耐药金葡菌、革兰阴性杆菌或白色念珠菌感染。

【注意事项】①用药前须做过敏试验。凡首次使用青霉素或停用青霉素超过 72h 以上者必须在试验阴性后方可使用。皮试浓度为 500U/ml,注入皮内 0.1ml(50U),形成直径 0.5cm 的皮丘,20min 后观察局部反应，皮丘无改变，周围无红肿即为阴性。②与青霉胺或头孢菌素可有交叉过敏性。③本品可经乳汁分泌使婴儿致敏。有青霉素过敏史患者禁用。有过敏疾患与过敏状态的患者忌用。有其他

需要全本请访问 www.ertongbook.com

药物过敏史者慎用。肾功能严重损害时应慎用。高钾病人禁用。④青霉素 G 一直是临床广泛应用的抗生素。主要优点是杀菌作用强，毒性作用小。主要缺点是抗菌谱窄，对肠道阴性杆菌无效；口服不吸收，对酸不稳定 约 80%金黄色葡萄球菌对青霉素 G有不同程度耐药；而且有严重的过敏性反应。价格便宜。

青 霉 素 V
Phenoxymethylpenicillin

【别名】 苯氧甲基青霉素钾，Penicillin V，Compocillin-VK

【化学名称】 6-苯氧基乙酰胺基青霉烷酸

【化学分子式】 $C_{16}H_{18}N_2O_5S$

【剂型、性状】 片剂：125mg，300mg，500mg。白色结晶粉末，易溶于水，在胃内溶解度高于游离酸。

【药理作用】其抗菌谱与青霉素 G 相同，主要作用于革兰阳性细菌。对耐药金黄色葡萄球菌比青霉素 G 作用强。

【体内过程】具有对酸稳定的特点，口服 65%可被胃肠道吸收，达峰时间在 0.75h以内，血清蛋白结合率为 75.6% ~80%，给药后 10h 内尿中排出给药量 37% ~43%。$t_{1/2}$为 1h。

【临床应用】主要应用于革兰阳性菌引起的轻度感染，适用于扁桃体炎、咽炎、猩红热、支气管炎、肺炎及疖、痈、蜂窝组织炎、脓肿、齿槽脓肿等，也可作为预防风湿热复发和感染性心内膜炎的选用药物。

【用法用量】口服每次剂量：5 岁以下 125mg (20 万 U)，6 ~12 岁 250mg，12 岁以上及成人250 ~500mg，3 ~4/d，饭后 1h 服用。

【不良反应】青霉素 V 毒性较低，少数患者有胃肠道反应如烧灼感、恶心呕吐、腹泻等。

【注意事项】同青霉素 G。

普鲁卡因青霉素
Procaine Benzylpenicillin

【别名】青霉素混悬液，普鲁卡因青霉素 G，普青，Procaine Penicillin，Duracillin，Crysticillin

【化学名称】苄青霉素的 2-(二乙氨基)乙基对氨基苯甲酸盐水合物

【化学分子式】 $C_{13}H_{20}N_2O_2 \cdot C_{16}H_{18}N_2O_4S \cdot H_2O$

【剂型、性状】 ①粉针剂：每瓶 40 万 U(含青霉素 G 普鲁卡因 30 万 U，青霉素 G 钾盐或钠盐 10 万 U)或 80 万 U(二者含量加倍)，既有长效，又有速效，一般可维持药效 24h；②油剂：为普鲁卡因青霉 G 的灭菌油混液，每瓶 300 万 U(10ml)。白色结晶性粉末，遇酸、碱或氧化剂等即迅速失效。易溶于甲醇中，略溶于乙醇或氯仿中，微溶于水中。

【药理作用】本品为青霉素 G 的普鲁卡因盐。深部肌肉注射后，青霉素徐缓释放，因而起效缓慢，但较持久，一般 24 ~48h 给药一次，给药量的 60% ~90% 经肾排出。

【临床应用】常用于轻度感染和猩红热、肺炎的后期巩固性的治疗。亦可用于风湿热、细菌性心内膜炎、钩端螺旋体病、化脓性皮肤病和新生儿破伤风的防治(常与青霉素 G 合用或先后用)。

【用法用量】肌注：一次量为 40 万 ~80 万 U，1/d。

【不良反应】基本上与青霉素相同，亦可发生各种过敏反应。

【注意事项】对青霉素、普鲁卡因过敏者禁用。注意须作青霉素和普鲁卡因皮试，方法是取 0.25%盐酸普鲁卡因注射液 0.1ml，作皮内注射，15 ~20min 后观察结果，判断标准同青霉素。本品切不可作静脉注射或静滴。

苄 星 青 霉 素
Benzathine Benzylpenicillin

【别名】苄星青霉素 G，长效西林，比西林，Bicillin，Benzathine，Tardocillin

【化学名称】青霉素的二苄基乙二胺盐

【化学分子式】 $C_{16}H_{20}N_2 \cdot 2C_{16}N_{18}O_4S$

【剂型、性状】粉针剂：30 万 U，60 万 U，120 万 U 白色结晶性粉末，无臭，极难溶于水及乙醇。在酸中稳定，不被胃酸所破坏。

【药理作用】与青霉素相似，肌注后缓慢游离出青霉素而呈抗菌作用。体内吸收慢，排泄也慢，肌注后血浆有效浓度至少维持半月至 1 个月。

【临床应用】对青霉素 G 敏感菌所致的轻度或中度感染或需长期使用青霉素作预防治疗的患者，如肺炎、扁桃体炎、淋病等，还常用于风湿性心脏病、风湿热等患者的长期治疗。

【用法用量】每半月至 1 个月肌注一次，成人常用剂量 60 万 U ~120 万 U／次，小儿 5 万 U/kg。

【不良反应】 长期应用可影响肠内 B 族维生

素的合成，必要时宜与后者并用。

【注意事项】用药前须做过敏试验。

甲氧西林
Meticillin

【别名】美替西林，甲氧苯青霉素，新青霉素Ⅰ，Meticilline，P-35

【化学名称】 6-[2,6-二甲氧基苯甲酰胺] 青霉烷酸

【化学分子式】 $C_{17}H_{20}N_2O_6S$

【剂型、性状】粉针剂：1g。本品钠盐为白色结晶性粉末，在酸性溶液中不稳定，溶于水、乙醇，易溶于甲醇和吡啶，不溶于乙醚、丙酮、不挥发的油和液体石蜡。

【药理作用】作用与苄青霉素相似，但可以杀灭青霉素酶产生的和无青霉素酶产生的葡萄球菌，也可作用于B-溶血链球菌、链球菌等。

【体内过程】 肌肉注射吸收很快，注射1g，30min后血药浓度为10～21μg/ml，4h浓度下降为0.2mg%。排泄快，20%以上由胆汁中排出，在6h内尿中排出50%以上。

【临床应用】主要用于耐青霉素的葡萄球菌感染。

【用法用量】成人肌注1～3 g/次，4～6/d；儿童0.1～0.15g/(kg·d)，分4～6次。

【不良反应】本品和青霉素有交叉过敏，对金葡菌的抗菌作用较差，应用剂量大，且注射时疼痛明显。

【注意事项】国内已停止生产。

苯唑西林
Oxacillin

【别名】苯唑青霉素，新青霉素Ⅱ，Prostaphillin，Bactocil，P_{12}

【化学名称】 (2S,5R,6R)-3,3-二甲基-6-(5-甲基-3-苯基-4-异恶唑甲酞氨基) -7-氧代-4-硫杂-1-氮杂双环[3,2,0]庚烷-2-甲酸

【化学分子式】 $C_{19}H_{19}N_3O_5S$

【剂型、性状】片（胶囊）剂：0.25g。粉针剂：0.5g 为白色结晶性粉末，无臭或微臭，易溶于水，干燥时稳定。

【药理作用】 本品为半合成青霉素，耐青霉素酶，故对产酶金黄色葡萄球菌菌株有效。

【体内过程】 口服吸收良好，30%～33% 在肠道吸收，0.5～1h 血浓度达峰值。肌注后半小时血浓度达峰值，有效浓度可维持6h左右。约有94%的血浆蛋白呈可逆结合。在体内分布广，肝、肾、肠、脾、胸腔积液和关节囊液中均可达有效浓度，肺、腹水、正常脑脊液内含量甚低。口服和肌注后约30%～40%由肾排泄，而大部分在肝脏灭活。 $t_{1/2}$约为0.4h。

【临床应用】主要用于耐青霉素G的金黄色葡萄球菌感染和表皮葡萄球菌的周围感染，包括内脏、皮肤和软组织等部位的感染。多用于心内膜炎、烧伤、骨髓炎、脑膜炎、败血症、肺炎等。

【用法用量】 ①口服：一次0.5～1g，4/d，宜空腹时服。②肌注：一次1g，3～4/d。③静滴：一次1～2g，必要时可用到3g，溶于100ml输液内滴注1/2～1h，3～4/d。小儿每日用量50～200mg/kg，分次给予。肾功能轻中度不足者可按正常用量，严重不足者适当减量。

【不良反应】 ①口服给药后部分患者可出现上腹不适、腹胀、恶心呕吐、腹痛、腹泻和血清谷丙转氨酶升高。②大剂量注射时可引起抽搐等神经中毒反应。③婴儿用药后可出现血尿、蛋白尿等急性间质性肾炎症状。

【注意事项】 ①与青霉素G有交叉反应，即使口服给药亦须以青霉素G做皮试。②不宜与庆大霉素、四环素、磺胺嘧啶、去甲肾上腺素、间羟胺、维生素B族、维生素C、水解蛋白等配伍。③阿司匹林、磺胺药能阻止本品与血浆蛋白结合，因此两者并用时要适当减量。④青霉素过敏者禁用。有过敏性疾病、肝病、严重肾功能减退者或新生儿等慎用。

萘夫西林
Nafcillin

【别名】萘呋西林，乙氧萘青霉素，新青霉素Ⅲ，Nafecilline

【化学名称】 6-(2-乙氧基-1-萘酰氨基) 青霉素酸

【化学分子式】 $C_{21}H_{22}N_2O_5S$

【剂型、性状】 片（胶囊）剂：0.25g，0.5g。白色或黄色粉末，有轻微的特有气味，易溶于水和氯仿，溶于乙醇，3%的水溶液pH5～7。

【药理作用】与苯唑西林相同。

【体内过程】 钠盐从胃肠道吸收不完全也不规律，饭前用更为突出。口服0.5～1g，1h后血浆浓

度1.5～5μg/ml,肌肉注射吸收可靠,注射 500mg 在 1～2h 内,血浆浓度 5～8μg/ml，在人体组织内包括滑液中广泛分布，在循环中 90% 与血浆蛋白结合，通过肝代谢，由胆汁排出体外。饭前服用的 10%、肌肉注射的 30%从尿液中排出。

【临床应用】与氯唑西林（Cloxacilin）相同。

【用法用量】一次 0.25～1g,4～6/d。

【不良反应】同苯唑西林。

【注意事项】参见苯唑西林。

氯 唑 西 林
Cloxacillin

【别名】邻氯青霉素，邻唑西林，Orbenin

【化学名称】（2S,5R,6R）-3,3-二甲基-5-[5-甲基-3-(2-氯苯基)-4-异恶唑甲酰氨基]-7-氧代-4-硫杂-1-氮杂双环[3,2,0]庚烷-2-甲酸

【化学分子式】 $C_{19}H_{18}ClN_3O_5S$

【剂型、性状】胶囊剂 0.12g,0.25g,0.5g。粉针剂 0.5g。白色结晶性粉末，微臭，味苦，易溶于水,溶于乙醇,性较稳定。

【药理作用】类似苯唑西林，对产酶金黄色葡萄球菌有抗菌作用。

【体内过程】口服吸收达 50%,1h 血浓度达峰值。肌注 0.5g,半小时血浓度达峰值约 18μg/ml。能渗入急性骨髓炎的骨组织、脓液和关节腔及胸腔积液中。能透过胎盘屏障，不易透过血-脑脊液屏障。蛋白结合率可达 95%,$t_{1/2}$为 0.5～1h。

【临床应用】与苯唑青霉素相仿，但对金葡菌作用较强。主要用于产酶金黄色葡萄球菌或其他葡萄球菌所致的败血症、肺炎、心内膜炎、骨髓炎或皮肤软组织感染等。本品对金葡菌或与溶血性链球菌混合感染的急性骨髓炎,除全身用药外,配合局部骨髓内注入，疗效可达 90% 以上。由于本品刺激性小,在化脓性脑膜炎时可鞘内给药,配合肌注或静滴给药，可获满意效果。

【用法用量】①肌注：一次 0.5～1g,3～4/d。②静滴：一次 1～2g,溶于 100ml输液中,滴注 0.5～1h,3～4/d。小儿每日用量 30～50mg/kg,分次给予。口服剂量相同。

【不良反应】少数有轻度腹胀、恶心、呕吐、食欲缺乏、头昏、嗜睡等,一般可自行消失,不影响治疗。

【注意事项】①与青霉素有交叉过敏性。②与红霉素、四环素、庆大霉素、卡那霉素、维生素 C 和盐酸氯丙嗪有配伍禁忌。③阿司匹林、磺胺类药可抑制其与血浆蛋白结合，两药联用时宜减量。青霉素过敏者禁用。

双 氯 西 林
Dicloxacillin

【别名】双氯青，双氯苯唑青霉素， Dicloxin, Veracillin

【化学名称】6-[[[3-(2,6-氯苯基)-5 甲基-4-异恶唑]羰基]氨基]-3,3 二甲基-7-氧-4-硫杂-1-氮杂二环[3,2,0]庚烷-2-羧酸

【化学分子式】 $C_{19}H_{17}Cl_2N_3O_5S$

【剂型、性状】片（胶囊）剂 0.25g。钠盐为白色或类白色结晶性粉末，微臭，味苦，微有引湿性。易溶于水,微溶于丙酮、丁酸,极微溶于乙酸乙酯。

【药理作用】本品为耐酸耐酶窄谱半合成的青霉素。其抗菌谱和氯苯唑青霉素相同，作用类似。与青霉素 G 比较，对肺炎球菌抗菌作用为其 1/3,而对耐药菌的抗菌作用则比青霉素 G强 100 倍。对苯唑青霉素或氯苯唑青霉素耐药的金黄色葡萄球菌对本品敏感。

【体内过程】口服吸收完全，于 1h 左右达峰浓度,可持续 4h，血浆蛋白结合率近 97%,口服剂量的 70%从尿液中排出。

【临床应用】常用于对青霉素 G 耐药的链球菌、肺炎球菌及金黄色葡萄球菌引起的混合感染。

【用法用量】口服：成人 0.5g/次,2～4/d。儿童 30～50mg/(kg·d),分 4 次空腹服用。

[不良反应]常出现胃肠道反应，如恶心、呕吐、食欲缺乏、腹胀、腹泻等。有时可见皮疹、药热、AST 升高、头痛、偶见过敏反应。

【注意事项】用药前需做皮试，对青霉素过敏者忌用。新生儿及肝功能严重损害者慎用。

氟氯青霉素
Flucloxacillin

【别名】 氟氯苯唑青霉素,Floxapen

【化学名称】 5-甲基-3-(2-氯-6氟)苯基-4-异噁唑青霉素

【化学分子式】 $C_{19}H_{17}ClFN_3O_5S$

【剂型、性状】片剂 250mg,500mg 粉针剂：250mg,500mg。白色或淡黄色结晶性粉末,无臭,味苦，易溶于水。

【药理作用】其抗菌谱与苯唑西林相同,对耐药金葡菌比苯唑西林强。

【体内过程】口服胃肠道吸收好，口服后血药浓度于1h达峰值，蛋白结合率为97%，$t_{1/2}$为0.8h，服药后6h的尿排泄量为50%～60%。

【临床应用】主要用于耐药金葡菌的感染。但对耐甲氧西林的金黄色葡萄球菌（MRSA)感染无效。

【用法用量】口服，一次250mg,4～6h一次，饭前0.5～1h服。肌注:常用量一次250mg,3/d;重症一次500mg,4/d 静注：每次500mg,4/d。将药物溶于10～20ml 注射用水或葡萄糖输液中推注，一日量不超过8g。儿童按每日25mg/kg,分次给予。

【不良反应】可有胃肠道反应及皮疹等。

【注意事项】与青霉素G有交叉过敏反应,用药前需作青霉素皮试。注射时勿与血液、血浆、水解蛋白、氨基酸以及脂肪酸配伍。本品可使氨基糖苷类降效，不可配伍。

氨苄西林
Ampicillin

【别名】氨苄青,氨苄青霉素,安比西林,潘别丁,Penbritin,Ampicil

【化学名称】(2S,5R,6R)-3,3-二甲基-6-[(R)-2-氨基-2-苯乙酰氨基]-7-氧代-4-硫杂-1-氮杂双环[3,2,0]庚烷-2-甲酸

【化学分子式】$C_{16}H_{19}N_3O_4S$

【剂型、性状】片（胶囊）剂：0.25g;注射剂：0.5g,1.0g。白色结晶性粉末，无臭或微臭，味微苦，有引湿性,易溶于水,略溶于乙醇,不溶于乙醚。

【药理作用】为广谱半合成青霉素，对革兰阴性菌和阳性菌都有抑制作用，对大肠杆菌、流感杆菌、沙门菌、志贺菌和变形杆菌的抗菌作用较强,但对绿脓杆菌无效，对革兰阳性菌的抗菌作用不及青霉素G。氨苄西林曾长期作为广谱抗生素用于革兰阴性杆菌引起的尿路感染、胆道感染、肠道感染及术后感染等系统感染。但由于绿脓杆菌、克雷伯肺炎杆菌等阴性杆菌对氨苄西林天然耐药，原来敏感的大肠杆菌、沙门菌属、痢疾杆菌和流感杆菌又出现了许多耐氨苄西林耐药菌，因此氨苄西林已不适于重症阴性杆菌感染的首选药物。目前已将氨苄西林与青霉烷砜（Sulbactam）组成复合制剂优立新（Unasyn),使临床疗效明显提高。

【体内过程】本品口服吸收良好，口服和肌注后分别于2h和1h达到高峰浓度。在体内分布很广，尤以肝、肾浓度最高，在胆汁中的浓度平均为血浓度的9倍。蛋白结合率为20%～25%。进入体内的药物,有80%以原形由尿排出,$t_{1/2}$为1～1.5h。

【临床应用】①大肠杆菌、变形杆菌所致的败血症、泌尿系统感染、胆道感染。尤其在胆道梗阻患者术前应用，可有效控制并发败血症。②肺炎球菌、溶血性链球菌、金葡菌、流感杆菌和军团菌引起的肺炎。③伤寒，主要治疗对氯霉素耐药的伤寒患者及伤寒带菌者。④志贺菌属所致细菌性痢疾。⑤由肺炎球菌、脑膜炎球菌、流感杆菌和其他革兰阴性菌引起的儿童化脓性脑膜炎。

【用法用量】口服：一日量50～100mg/kg,分成4次服用。肌注：一次0.5～1g,4/d。静滴：一次1～2g 必要时可用至3g,溶于100ml输液中滴注0.5～1h,2～4/d。儿童用量为一日100～150mg/kg 分次给予。

【不良反应】①过敏反应：以皮疹最为常见，有时也可发生药热。②胃肠道反应：通常口服可有轻度恶心、呕吐、腹泻等症状。③大剂量应用时，可出现间质性肾炎。④约1/4口服给药患者可发生短暂的血清转氨酶升高。

【注意事项】①因与青霉素类有交叉过敏反应,用前需作青霉素G过敏试验。②静滴时应尽量少与碱性药物并用。③不宜与口服避孕药同服。④与硫酸链霉素、卡那霉素、庆大霉素、四环素和氯丙嗪混合，易立即产生沉淀反应。如与琥珀酸钠氢化可的松配伍，易降低药效。

海他西林
Hetacillin

【别名】缩酮氨苄青霉素,Etacillin

【化学名称】6-(2,2-二甲基-5-氧代-4-苯基-1-咪唑烷基）青霉烷酸

【化学分子式】$C_{19}H_{23}N_3O_4S$

【剂型、性状】片（胶囊）剂：0.125g,0.25g。注射剂:0.5g,1g。本品溶于二甲基甲酰胺、二甲基亚砜、吡啶、甲醇和大多数有机溶剂。水中不溶,可溶于稀NaOH溶液。

【药理作用】口服和注射给药后可迅速转变为氨苄西林(Ampicillin),产生药理作用。

【临床应用】同氨苄西林。

【用法用量】一日2～4g（相当氨苄西林225～450mg),4/d 口服或注射。

需要全本请访问 www.ertongbook.com

【不良反应】皮疹较多见，严重过敏反应，如过敏性休克有可能发生；胃肠道反应如恶心、呕吐、腹泻等

【注意事项】参见氨苄西林。

阿莫西林
Amoxicillin

【别名】 羟氨苄青霉素，Amoxil，Polymox

【化学名称】 (2S，5R，6R)-3，3-二甲基-6-[(R)-(-)-2-氨基-2(4-羟基苯基)乙酰氨基]-7-氧代-4-硫杂-1-氮杂双环[3，2，0]庚烷-2-甲酸三水合物

【化学分子式】 $C_{16}H_{19}N_3O_5S \cdot 3H_2O$

【剂型、性状】胶囊剂：0.25g；干糖浆：每包125mg；口服混悬剂：125mg/5ml，250mg/5ml。白色结晶粉末，味微苦，微溶于水，几不溶于乙醇。

【药理作用】 抗菌谱与氨苄西林相同。

【体内过程】口服后迅速吸收，约 75% ~90% 可自胃肠吸收。口服和肌注后达峰时间分别为 2h 和 1h。蛋白结合率为 17% ~20%。$t_{1/2}$ 为 1 ~1.3h。约 60% 口服药量于 6h 内经肾排出。

【临床应用】主要用于敏感菌所致的呼吸道、尿路、胆道感染以及伤寒等。在临床治疗伤寒中，对氯霉素耐药菌株感染及由于骨髓抑制无法再用氯霉素患者，阿莫西林为最佳取代药物，尤其对改善临床症状、降低复发率和其后带菌状态均较氯霉素优。此外本品对幽门弯曲菌敏感，因此临床用以治疗慢性活动性胃炎和消化性溃疡，口服 25% 混悬液 20ml，2/d，连续 2 周，幽门弯曲菌转阴率达91%。

【用法用量】 成人，1 ~4g/d，分为 3 ~4 次服。儿童，一日 50 ~100mg/kg，分 3 ~4 次服。肾功能严重不足者应延长用药间隔，肾小球滤过率(GFR)为 10 ~15ml/min 者 8 ~12h 给药一次；<10 ml/min 者 12 ~16h 给药一次。

【不良反应】副作用发生率大约 5% ~6%。以消化道反应和皮疹为主，少数病人的血清转氨酶升高，偶有嗜酸性粒细胞增多和白细胞降低。部分女性患者在用药期间可因念珠菌感染引起外阴瘙痒。

【注意事项】用药前做皮试，青霉素过敏者禁用。

匹氨西林
Pivampicillin

【别名】匹氨青霉素，匹呋氨苄青霉素，匹呋青霉素，Inacillin，Alphacillin，Pondocillin

【化学名称】 D-(-)-6-(2-氨基-2-苯乙酰氨基)青霉烷酸羟甲酯三甲基乙酸酯

【化学分子式】 $C_{22}H_{29}N_3O_6S$

【剂型、性状】胶囊剂：0.25g。其盐酸盐为白色结晶性粉末，有特异臭，味苦，易溶于水，在酸性溶液中较稳定。

【药理作用】本品为氨苄西林的双酯化合物，吸收后在血和组织中为酯酶所水解而发挥作用，因此其抗菌作用和氨苄西林近似。其优点是对酸的稳定性高，在胃中损失少。

【体内过程】口服吸收快而完全，血浆浓度 1h 达峰，在组织和体液中浓度较高。24h 尿排出量为服药量的 56%。

【临床应用】临床应用范围与氨苄西林同。适用于尿路感染、呼吸道感染、皮肤和软组织感染、伤寒等。

【用法用量】口服：一般感染，一日量为 1.5 ~2g，分 3 ~4 次服，重症应加量。儿童 40 ~80mg/(kg·d)，分 3 ~4 次服。

【不良反应】常见有腹部不适、腹痛、厌食、恶心、呕吐、腹泻和药疹。个别人可有转氨酶上升，停药后可恢复。不良反应发生率较氨苄西林高。

【注意事项】本药味苦，且有特殊气味，服时应将胶囊吞下，不得咬碎。每次与流质饮食同服，可减轻胃肠道反应。青霉素过敏者禁用。

羧苄西林
Carbenicillin

【别名】卡比西，羧苄青霉素，羧苄青，Pyopen，Carbecin，Anabacty

【化学名称】 6-[(羧基苯乙酰)胺基]-3，3-二甲基-氧-4-硫杂-1-氮杂双环[3，2，0]庚烷-2-羧酸

【化学分子式】 $C_{17}H_{18}O_6N_2S$

【剂型、性状】注射剂：0.5g，1g。为白色或类白色粉末，引湿性强，遇热不稳定，易溶于水，溶于乙醇、甲醇，不溶于其他有机溶剂。

【药理作用】为半合成的抗假单胞菌青霉素。对革兰阳性菌的作用类似氨苄西林但稍弱，对产酶

金黄色葡萄球菌无效，对革兰阴性菌的抗菌谱较氨苄西林为广，包括绿脓杆菌吲哚阳性变形杆菌、部分沙雷杆菌、部分肠杆菌以及部分拟杆菌等。但多数的绿脓杆菌敏感性差，本品只有高浓度时才有可靠的抗菌作用。羧苄西林主要用以治疗全身性绿脓杆菌感染，但由于本品对绿脓杆菌抗菌活性差，而且已发现耐羧苄西林菌株，所以逐渐为其他抗假单胞菌属药物所替代，但临床应用治疗变形杆菌属感染仍可获良好疗效。

【体内过程】口服不吸收，肌注后血药浓度通常于 1h 达高峰，静注后血药浓度约为肌注的 4 倍。$t_{1/2}$约 1h。进入体内的药物约 80% ~90% 由尿排泄。血浆蛋白结合率约为 50%，在体内分布广，肺、支气管分泌液、胸腹水、胆汁和脑膜炎脑脊液中均可达到较高浓度。

【临床应用】①主要用于绿脓杆菌及其他敏感细菌引起的系统感染，如败血症、肺部感染、尿路感染、胆道感染及脑膜炎等。②厌氧菌引起的腹腔感染，如阑尾炎穿孔、肠梗阻、坏死性肠炎、细菌性肝脓肿等。③烧伤继发感染，可在全身系统用药的同时，配合 0.2% 羧苄青霉素溶液局部湿敷，可更快清除创面细菌。④盆腔感染，如分娩后子宫内膜炎、子宫积脓、盆腔蜂窝组织炎、产褥热和剖宫产后伤口感染。

【用法用量】①肌注，成人每日 4 ~8g，分 4 次肌注。②静滴，成人每日 10 ~20g，儿童每日 100 ~300mg/kg。③胸腔、腹腔和关节腔给药时，每次 0.5 ~1.0g。④鞘内给药，每次 40mg。⑤本品 0.5 ~1.0g 溶于 3 ~5ml 水中可作雾化吸入。⑥配制 2% 溶液可作局部湿敷或膀胱冲洗。

【不良反应】个别患者可有转氨酶上升及偶有皮疹，停药后，可逐渐恢复正常。

【注意事项】①本品与青霉素 G 有交叉过敏反应，故用前应作皮试。青霉素 G 过敏者禁用。②本品为双钠盐，含 Na^+ 4.7mmol/g（相当于 4.7mEq/g），大剂量静点可出现高钠血症，因此用药期应适当限钠补钾。③大剂量静注，特别是有肾功能损害者，可引起紫癜和粘膜出血，因此剂量不宜超过 500mg/(kg·d)。④不宜与琥珀酸钠氢化可的松和右旋糖酐混合静滴，易降低其稳定性。

磺苄西林
Sulbenicillin

【别名】卡达西林，磺苄青霉素，Kedacillin

【化学名称】2-磺酸基苄基青霉素

【化学分子式】$C_{16}H_{18}N_2O_7S_2$

【剂型、性状】注射剂：磺苄西林钠：每瓶 1g（100 万 U）、2g（200 万 U）、3g（300 万 U）。本品为半合成的抗假单胞菌青霉素，1mg 相当于 1000U。为白色结晶性粉末，易溶于水、甲醇，微溶于乙醇，难溶于丙酮。

【药理作用】抗菌谱与羧苄西林相似，抗菌作用较强，此外，金黄色葡萄球菌对本品也较敏感。

【体内过程】给药后血药浓度于 2h 达峰值。24h 尿中排泄量为给药量的 80%。在胆汁中亦可具有相当血浓度 3 倍的含量。

【临床应用】适用于绿脓杆菌、肠杆菌属、变形杆菌和其他敏感细菌引起的化脓性感染、烧伤、呼吸道、泌尿道、胆道、软组织感染以及耳鼻喉科和妇产科的感染性疾病。

【用法用量】成人用量 4 ~8g/d，分 4 次肌注或静滴，肌注时须加用 0.5% 利多卡因 3ml 以减轻疼痛，重症患者可增量至 20g/d。儿童剂量按每日 40 ~160mg/kg 给药。

【不良反应】本品含钠量较高（4.37mmol/g），大剂量应用时可出现电解质紊乱，并可导致出血倾向。

【注意事项】①应用时需做青霉素皮试。青霉素过敏者禁用，肝肾功能不全者慎用。②与氨基糖苷类抗生素联合应用时，应分开给予，勿置同一容器中，以免互相影响效价。

呋布西林
Furbenicillin

【别名】呋脲苄青霉素，呋苄青霉素，呋苄西林，呋喃酰脲青霉素钠，Furbucillin

【化学名称】6-[D-α-[3-(2 呋喃甲酰）脲基]苯乙酰胺基]青霉烷酸

【化学分子式】$C_{22}H_{22}N_4O_7S$

【剂型、性状】注射用呋布西林钠：0.5g。注射用呋布西林钾 0.5g。白色或微黄色结晶性粉末。微臭，味苦。溶于水，微溶于乙醇。

【药理作用】本品对绿脓杆菌有较强的抗菌作用，体外抑菌试验时比羧苄西林强 4 ~16 倍。对其他革兰阳性菌和阴性菌的作用类似氨苄西林。

【体内过程】本品口服吸收差，静脉给药后可维持较高血药浓度，可分布至各脏器和体液中，但以胆汁和尿液浓度最高。$t_{1/2}$为 1.08h。血清蛋白结合

率为 90%。

【临床应用】主要用于绿脓杆菌引起的烧伤创面感染，尿路、肺部、肝胆系统和腹腔感染，化脓性脑膜炎和败血症等。

【用法用量】静滴：成人每日 4～8g，分 4 次给药，加入 5% 葡萄糖溶液 50～100ml 中，在 1/2～1h 滴完。极重感染时可加大剂量到 12g/d。小儿一日量为 100～150mg/(kg·d)，必要时酌情增加，疗程 2周。

【不良反应】部分病人产生恶心呕吐、食欲下降等消化道不良反应。偶有口周、面部和四肢皮肤麻木感，严重时有肌颤等。

[注意事项] ①使用前必须用青霉素 G 做过敏试验。青霉素过敏者忌用。②浓度不宜超过 2%，因浓度过高能引起滴注部位静脉刺激疼痛。③凡是肝肾功能不全或造血系统受抑制的情况应注意检查肝肾功能与血常规。

哌拉西林
Piperacillin

【别名】氧哌嗪青霉素，Pailaxillin

【化学名称】(2S,5R,6R)-3,3-二甲基-6-[(4-乙基-2,3-二氧代-1-哌嗪甲酰氨基)苯乙酰氨基]-7-氧代-4-硫杂-1-氮杂双环[3,2,0]庚烷-2-甲酸

【化学分子式】$C_{23}H_{27}N_5O_7S \cdot H_2O$

【剂型、性状】注射用哌拉西林钠：0.5g，1g。为白色结晶性粉末，无臭，略有引湿性。在甲醇中易溶，在无水乙醇或丙酮中溶解，在水中极微溶解。

【药理作用】系一酰脲类青霉素。抗菌谱广，对革兰阳性、阴性菌均有良好的抗菌活性，本品主要用于绿脓杆菌、大肠杆菌以及其他肠杆菌科细菌所致的各种感染，包括败血症、肺部感染、胆道感染、腹腔感染、妇科感染、尿路感染等，临床有效率和细菌清除率平均为 80%～90%。

【体内过程】本品口服不吸收，肌注 1g 后，血清药物浓度于 0.5～1h 达峰值。$t_{1/2}$ 约为 1h。体内分布较广，周围器官均可达有效浓度，在胆汁和前列腺液中有较高浓度。血清蛋白结合率为 17%～22%。12h 尿中排出量为给药量的 49%～68%。

【临床应用】①创伤和手术后感染。②重症败血症、腹腔或妇科盆腔厌氧菌感染。③轻中度泌尿道、呼吸道或胆道感染。

[用法用量] 肌注：成人 4～8g/d，分 3～4 次注射；小儿每日 80～100mg/kg，分 3～4 次注射。静注或静滴，4～16g/d，分次给药；小儿每日 100～300mg/kg，分次给药。

[不良反应] 临床应用中不良反应少。常见者有食欲减退、腹泻等胃肠道反应，多数程度较轻。偶有皮疹、药物热、皮肤瘙痒等。大剂量治疗中可以发生出血时间改变和低钾血症，但远较羧苄西林为少。

[注意事项] ①与青霉素类产生交叉过敏性。青霉素过敏者忌用。②不宜与抗凝血药和非甾体类抗炎药并用，以防引起凝血机能障碍导致出血。③肾功能减退患者应适当减量。

替卡西林
Ticarcillin

【别名】羧噻吩青霉素，Monapen，Ticarpen

【化学名称】N-(2-羧基-3,3-二甲基-7-氧代-4-硫杂-1-氮杂二环[3,2,0]庚-6-基)-2-(噻吩-3-基)丙酰胺酸

【化学分子式】$C_{15}H_{16}N_2O_6S_2$

【剂型、性状】注射用替卡西林钠：每瓶 1g，3g，6g 乳白色粉末，具吸湿性，易溶于水，水溶液稳定。

【药理作用】其抗菌谱与羧苄西林相似，抗绿脓杆菌活性强 2～4 倍，对其他阴性杆菌和脑膜炎球菌、淋球菌亦有较强疗效。临床用于全身性绿脓杆菌感染和尿路感染效果甚好。对于绿脓杆菌感染常需与氨基糖苷类抗生素联合应用。目前用替卡西林与 β-内酰胺酶抑制剂棒酸配制成复合制剂——泰门汀(特美汀，Timentin)，使其抗菌谱扩大到对替卡西林和其他 β-内酰胺类抗生素耐药的许多产 β-内酰胺酶菌株。用以治疗金葡菌、耐药革兰阴性菌和厌氧菌感染病人可明显增效。

【体内过程】本品口服不吸收，注射给药后血浓度迅速达到峰值，$t_{1/2}$ 为 1h，血清蛋白结合率为 50%～60%，体内分布较广，可渗透人脑脊液和胎盘，胆汁中浓度也较高。给药量的 80% 于 6h 内自尿排出。

【临床应用】主要适用于治疗由绿脓杆菌及敏感的革兰阴性杆菌所致的败血症、呼吸道感染、胆道感染、腹腔感染、尿路感染及女性生殖道感染等。

【用法用量】成人肌注一次 0.5～1g，4/d，静注或静滴 8～12g/d，分 2～3 次给予，重症感染每日 18～24g。儿童一日用量 200～300mg/kg，婴儿一日量 225mg/kg，7 日龄以下婴儿则为一日 150mg/

kg 均分次给予。

【不良反应】常见副反应有恶心、呕吐、腹泻等胃肠道反应。大剂量应用可引起电解质和酸碱平衡失调。偶可抑制血小板功能导致出血。

【注意事项】青霉素过敏者忌用。

阿洛西林
Azlocillin

【别名】阿乐欣，唑酮氨青霉素，Azlin, Abrodil

【化学名称】α-（咪唑啉酮甲酰胺）-α-苯甲基青霉素

【化学分子式】$C_{20}H_{23}N_5O_6S$

[剂型、性状]粉针剂：0.5g, 1.0g, 2.0g。钠盐制品不含结晶水分，为白色至微灰黄色粉末，极易溶于水。水溶液透明，无色至灰黄色 pH6.0～8.0。

【药理作用】本品是在美洛西林侧链 α-胺基上减少了甲磺酰基。抗菌谱类似美洛西林钠，本品不耐金葡菌的青霉素酶和肠杆菌科细菌所产生的 β-内酰胺酶。绿脓杆菌对本品的耐药性有时发展较快。氨基糖苷类与本品联合应用可加强对绿脓杆菌和一些革兰阴性菌的作用。

[体内过程]静注本品 1g、2g 或 5g 后 30min，血药浓度分别为 35、106 和 256μg/ml；4h 血药浓度分别为 2.2、7.4 和 33μg/ml。

【临床应用】主要用于绿脓杆菌敏感株所引起的感染，也用于革兰阴性杆菌中敏感菌株和粪链球菌引起的下呼吸道、腹腔、胆道、尿路、妇科、骨和关节、皮肤和软组织部位的感染，也用于败血症。

【用法用量】本品可静注或加入输液 100ml 静脉输注。轻度感染（如无合并症的尿道炎等）每日 100～125mg/kg，成人可按每次 2 g，每 6h 一次。中度感染每日 150～200mg/kg，成人可按每次 3g，每 6h 一次。重度感染每日 225～300mg/kg，成人可按每次 3 g，每 4h 一次，或每次 4g，每 6h 一次。肾功能受损者用量：肌酐清除率 > 30ml/min 者按正常剂量。10～30ml/min 者：轻度感染按每次 1.5g，每 12h 一次中度感染按每次 1.5g，每 8h 一次重度感染按每次 2g，每 8h 一次。< 10 ml/min 者轻度感染按每次 1.5g，每 12h 一次；中度感染按每次 2.0g，每 12h 一次重度感染按每次 3g，每 12h 一次。儿童用量酌减。

【不良反应】参见哌拉西林钠。

【注意事项】参见哌拉西林钠。

美洛西林
Mezlocillin

【别名】磺唑氨苄青霉素，Mezlin, Sudium Mezlociline

【化学名称】α-[3-甲磺酰-2-咪唑啉酮-(2)甲酰胺]α-苯基青霉素

【化学分子式】$C_{21}H_{25}N_5O_8S_2$

【剂型、性状】粉针剂：0.5g, 1.0g, 2.0g。钠盐为单水化合物，暗黄色结晶，溶于水、乙醇。

【药理作用】本品是在氨苄西林侧链 α-胺基上增加甲磺酰咪唑烷酮甲酰基，增强了对革兰阴性菌的活性，且保持了对阳性菌的活性。尤其是对绿脓杆菌、赛氏杆菌、大肠杆菌、肺炎杆菌、志贺菌、吲哚反应变形杆菌、沙雷菌以及大部分厌氧菌有优越的抗菌活性。杀菌作用强大。对 β-内酰胺酶较稳定，可用于耐药菌株。

【体内过程】口服不吸收，静注或肌肉注射，属二室开放型动力学模型，半衰期是剂量依赖型的，静注时半衰期 1h 肌注时半衰期 1.5h。组织穿透力强，分布广泛，易于透过血-脑脊液屏障，脑脊液药物浓度高，胆汁中浓度在静滴 2g(1h)时最高可达 248～1070μg/ml。

【临床应用】适用于大肠杆菌、肠杆菌属、变形杆菌等革兰阴性杆菌中敏感菌株所致的呼吸道系统、泌尿系统、消化系统、妇科和生殖器官等感染。对败血症、化脓性脑膜炎、腹膜炎、骨髓炎、皮肤及软组织感染，眼科及耳鼻咽喉科感染均有较好疗效。

【用法用量】成人常用量 2～6g/d，严重感染可增至 8～12g/d，最大可增至 15g/d。儿童用量 100～200mg/(kg·d)，严重感染可增至 300mg/(kg·d)，肌肉注射每天 2～4 次。静脉滴注按需要 6～8h 一次，其剂量根据病情，严重病例可每 4～6h 静脉推注一次。

【不良反应】毒副作用轻微，偶尔有皮疹、腹泻、恶心、呕吐。肌肉注射可有局部疼痛。

【注意事项】对青霉素过敏者禁用，用前要做皮试。避免与酸碱性较强的药物配伍。

美西林
Mecillinam

【别名】氮脒青霉素，Amdinopenicillin, Coactin

【化学名称】 6-[(六氢-1H-氮䓬基,-1-基)亚甲基氨基]青霉烷酸

【化学分子式】 $C_{15}H_{23}N_3O_3S$

【剂型、性状】粉针剂0.5g,1g。为白色结晶性粉末,味苦,易溶于水,略溶于无水乙醇。

【药理作用】其抗菌谱较窄，对革兰阳性菌作用微弱,对革兰阴性菌有较强的杀菌作用,包括大肠杆菌、克雷伯杆菌、肠杆菌属、枸橼酸杆菌、志贺菌、沙门菌和部分沙雷杆菌等有良好的抗菌作用；但对假单胞菌、吲哚阳性变形杆菌、奈瑟菌属、厌氧杆菌和肠球菌等无效。本品对β-内酰胺酶的耐受性较氨苄西林强。与其他青霉素或头孢菌素联合可起协同作用,例如与氨苄西林、哌拉西林、头孢唑啉、头孢孟多、头孢西丁等联合在体外均显示协同作用。某些肠道杆菌单独对本品或其他β-内酰胺类药物耐药时,将两药联合应用,常可变为敏感。除适用于上述细菌的耐药菌株外，对一些吲哚阳性变形杆菌和某些普鲁威登属菌亦有效。

【体内过程】本品口服不吸收，注射后41min血药浓度达峰值，在体内分布广泛，其浓度依次为尿液、胆汁、肾、肝和肺组织等。$t_{1/2}$为51～55min。血浆蛋白结合率为15%～25%。约70%的药物可经尿排泄。

【临床应用】主要用于革兰阴性菌所致的尿路感染，包括急、慢性单纯和复杂性的肾盂肾炎、膀胱炎和尿道炎。也可用于细菌性痢疾、伤寒、败血症等。临床用于大肠杆菌以及某些敏感肠杆菌科细菌所致的各种尿路感染可获满意疗效，尤其治疗孕妇菌尿症，细菌清除率可达87%。对耐氯霉素、耐氨苄西林菌株感染的难治性伤寒患者，有一定的治疗效果,其痊愈率为73%。但对于严重感染的病例，应考虑加用其他β-内酰胺类抗生素。

【用法用量】肌注、静注或静滴，成人每日1.2～3.2g,小儿每日30～60mg/kg,分3～4次注射。一疗程为7～10d。

【不良反应】偶见皮疹、头晕、肌注部位疼痛及菌群交替等。

【注意事项】用药前需做青霉素皮试。本品水溶液不稳定，溶解后应立即注射。青霉素过敏者禁用。妊娠前3个月孕妇禁用。肾功能不全者慎用。

匹美西林
Pivmecillinam

【别名】 Mellicin,Selexid

【化学名称】 (6R)-6-(过氢氮杂䓬-1-基-甲烯氨基)青霉素三甲基乙酰氧甲酯

【化学分子式】 $C_{21}H_{23}N_3O_5S$

【剂型、性状】片(胶囊)剂0.25g。盐酸盐白色结晶性粉末，溶于水。

【药理作用】为美西林酯,口服吸收后在体内水解生成美西林，抗菌作用与美西林相同。对革兰阴性菌感染尤其佳。

【体内过程】口服400mg,1～2h后Mecillinam血浆浓度可达到5μg/ml,剂量加倍时血浆中浓度也接近倍数。半衰期约1～1.4h,服药6h内,约45%以Mecillinam形式从尿液排出。

【临床应用】与美西林相同。

【用法用量】口服，呼吸道、泌尿道感染：0.25g/次,2/d，重症加倍。伤寒：按上述量4/d,连服14d。

【不良反应】可发生过敏性反应、胃肠道紊乱和荨麻疹。

【注意事项】青霉素类和头孢素类过敏者禁用。

替莫西林
Temocillin

【别名】羧噻吩甲氧青霉素

【化学名称】 6β-(2-羧基-2-噻吩-3-基乙酰胺基)-6α-甲氧基青霉烷酸

【化学分子式】 $C_{16}H_{18}N_2O_7S_2$

【剂型、性状】粉针剂0.5g,1g。无定形固体。

【药理作用】本品为耐β-内酰胺酶的半合成青霉素，对肠杆菌科细菌和其他一些革兰阴性菌有较好抗菌活性。

【体内过程】肌注后2h血药浓度达峰值，蛋白结合率约85%。$t_{1/2}$为4.5～5.4h,24h尿中排出量为给药量的81%。在肾功能减退时将有蓄积现象,血清半衰期可延长至15～20h。

【临床应用】主要适用于除绿脓杆菌以外的需氧革兰阴性菌所致的尿路感染、呼吸道感染、败血症、腹膜炎、手术后创口感染、胆道感染及淋病等。

【用法用量】肌注，14岁以上每日1～2g,每

12h 注射一次。

【不良反应】偶见皮肤瘙痒及恶心、呕吐、腹泻等消化道反应。

【注意事项】 青霉素过敏者禁用，妊娠及哺乳期妇女、肾功能不全者慎用。

新　灭　菌
Biflocin

新灭菌是由氟氯西林和阿莫西林按 1∶1 比例组合而成的复合物。

【剂型、性状】小儿新灭菌胶囊 250mg × 10/盒 新灭菌胶囊 500mg × 10/盒 新灭菌针剂 500mg/瓶；1000mg/瓶。白色粉末。

【药理作用】①氟氯西林：抑制 β-内酰胺酶，主要杀灭产 β-内酰胺酶的金葡菌。耐酸、耐酶，可口服。血清蛋白结合率低，游离浓度高，抗金葡菌作用较强。②阿莫西林：抑制细菌外层胞壁合成使之迅速成为球形而破裂溶解。抗菌谱、抗菌活性与氨苄西林相似但对肺炎双球菌等杀菌作用强于氨苄西林。经胃肠道吸收良好。血浓度为同类氨苄西林的 2 倍，杀菌作用迅速而强。③新灭菌 耐酸、耐酶，胃肠道吸收好，副作用少，血浓度高，生物利用度大于 90%，体内分布广，组织体液中有很高的浓度。

【临床应用】为治疗耐药金葡菌感染的首选药，对其他革兰阳性菌也有效。对金葡菌心内膜炎和病因未明的心内膜炎及急慢性骨髓炎也可用作首选药。对肺炎双球菌，变形杆菌有较强的杀灭作用。可用于①呼吸道 肺炎、肺脓肿、急慢性支气管炎、感冒的继发感染。②消化道 肝、胆道感染和急性肠胃炎。③泌尿道 淋病、软下疳、淋病性尿道炎、肾盂肾炎或膀胱炎。④口腔和耳鼻咽喉 急慢性中耳炎、急性齿槽炎、鼻窦炎、急性化脓性扁桃体炎等。⑤皮肤和软组织 疖、痈、蜂窝织炎、皮肤溃疡感染。⑥骨和关节 骨髓炎、化脓性关节炎。⑥其他 耐药金葡菌心内膜炎、败血症、白喉、创面及术后化脓感染、百日咳、钩端螺旋体病。

【用法用量】一般用法：成人，新灭菌 200mg 静滴 2/d或肌注 2/d。小儿，新灭菌每日 200mg/kg，分 2 次静滴或肌注。

【不良反应】对青霉素及头孢菌素过敏者禁用。其他与青霉素类所致副作用基本一致。

【注意事项】①肌注及静滴前必须用本药做过敏试验(皮试)，口服则不用做过敏试验。②肾衰病人当肌酐清除率＜ 10ml/min时剂量适当减少。

克　菌
Compliscan

克菌为含阿莫西林 + 双氯西林的复合剂型抗生素。每个胶囊 375mg(阿莫西林 250mg + 双氯西林 125mg)。具有二者的抗菌谱和适应证，口服 1 粒/次，3/d，严重感染加倍。儿童剂量减半。

氨苄西林／氯唑西林
Ampicillin-Cloxacillin

【别名】白萝仙

【剂型、性状】胶囊剂：含氨苄西林 250mg、氯唑西林 250mg。白色粉末，装入绿色胶囊中。

【药理作用】氨苄西林为广谱抗生素，作用于细菌的中隔细胞壁，使细菌形成丝状体而灭亡，但它对革兰阳性菌和阴性菌产生的 β-内酰胺酶不稳定，易被破坏失去抗菌作用 氯唑西林属耐酶青霉素，单独只应用于产青霉素酶的非 MRSA (耐甲氧西林金葡菌)金葡菌，它同时又是可逆的竞争性 β-内酰胺酶抑制剂，氯唑西林可与底物竞争酶的活性部位，使酶一时失活，致氨苄西林免遭破坏以发挥其抗菌作用。

【体内过程】氨苄西林正常人空腹口服 1g 的血药峰浓度于 2h到达，为 7.6mg/L，食物影响吸收；静脉注射 0.5g 后 15min 的血药浓度为 17mg/L，口服吸收后分布良好，注射给药后炎症脑脊液、胸膜水、痰均可达有效浓度，胆汁中浓度远超过血浓度，其血清蛋白结合率为 20%，血清半衰期为 1～1.5h。药物主要从尿排出，少量由胆汁排出在肝中灭活。氯唑西林空腹口服 0.5g 的血药峰浓度为 9.1mg/L，肌肉注射 0.5g 的血药峰浓度则为其 2 倍。氯唑西林在胸腔积液中有较高浓度，并能渗入急性骨髓炎的骨组织、脓液和关节腔积液中，难以透过血-脑脊液屏障。其排出途径主要经尿，有一定量经胆汁排出，少量在肝内代谢。

【临床应用】同奥格门汀。由于组成本品的两种抗生素均主要由尿排出，因此对产酶淋球菌等引起的泌尿系感染，效果较好。

【用法用量】成人 1 粒(轻感染)，稍重感染 2 粒，每 4～6h 一次，空腹服用 儿童一日量分别以两药各 50mg/kg 投药，分 4 次服用。

【不良反应】口服本品后可有胃肠道反应，氨苄西林皮疹发生率较高，其他可有血清转氨酶升高、

需要全本请访问 www.ertongbook.com

血小板或中性粒细胞减少和间质性肾炎等，但均少见。偶有白色念珠菌引起的二重感染与伪膜性肠炎。

【注意事项】严重肝功能减退者需严密观察，严重肾功能减退者调整剂量。青霉素过敏者禁用。

二、头孢菌素类抗生素

头孢噻吩钠
Cefalotin Sodium

【别名】先锋Ⅰ，头孢金素，噻孢霉素，西保力新，Cephalothin，Keflin，CET

【化学名称】7-(2-噻吩乙酰氨基)-头孢烷酸

【化学分子式】 $C_{16}H_{16}N_2O_6S_2$

【剂型、性状】粉针剂：0.5g。为白色结晶性粉末，几乎无臭，味苦，具引湿性，受热分解。易溶于水、生理盐水及葡萄糖溶液中。

【药理作用】本品是第一个化学半合成的头孢菌素，为广谱杀菌剂，主要为对抗革兰阳性菌，对革兰阴性菌的抗菌作用小。由于本品对葡萄球菌所产生的青霉素酶的水解作用有较强的抵抗力，对金葡菌菌株的药敏在1μg/ml以下，肠球菌则大多数耐药。革兰阳性杆菌如炭疽、破伤风杆菌、白喉杆菌等对本品高度敏感。对革兰阴性菌中的脑膜炎双球菌、沙门菌、痢疾杆菌、流感杆菌、百日咳杆菌、肺炎杆菌、奇异变形杆菌等均有较好的抗菌作用。绿脓杆菌与结核杆菌对本品耐药。对细菌的作用机制与青霉素相似，干扰细菌细胞壁的合成，为繁殖期杀菌剂。

【体内过程】口服胃肠道不吸收，故临床应用时均为肌注或静注给药，注射20～30min后达峰浓度.

【临床应用】主要用于耐青霉素金葡菌及一些革兰阴性杆菌引起的各种严重感染，如肺部感染、尿路感染、败血症、脑膜炎、腹膜炎、心内膜炎等。

【用法用量】肌注或静注：成人2～6g/d，儿童50～100mg/(kg·d)，分2～4次，以注射用水或生理盐水溶解供肌注；以生理盐水或5%、10%葡萄糖液20～30ml溶解，供缓慢静注，稀释后可静滴。

【不良反应】①可引起过敏反应，如皮疹、过敏性休克。②肌注部位疼痛。③偶有胃肠反应。肝、肾功能轻度减退，转氨酶升高，并可引起抗人球蛋白试验阳性反应。

【注意事项】①以生理盐水或葡萄糖溶液稀释后遇冷可出现白色结晶，加温后即可溶解。②本品不可与其他药物配伍。③用前应做皮试。

头孢噻啶
Cefaloridine

【别名】先锋Ⅱ，头孢利素，Cephaloridin，Cefloriη，CER

【化学名称】1-[[2-羧基-8-氧代-7-[(2-噻吩基乙酰基)氨基]-5-硫杂-1-氮杂二环[4,2,0]-2-辛烯基-3-基]甲基]吡啶嗡氢氧化物内盐

【化学分子式】 $C_{19}H_{17}N_3O_4S_2$

【剂型、性状】粉针剂：0.5g，1g。白色或类白色结晶性粉末，有微臭，味苦，易溶于水，水溶液呈微酸性。

【药理作用】本品为广谱抗生素，抗菌谱和作用机制与头孢噻吩相似。抗菌作用比后者强，对溶血性链球菌、肺炎球菌、金黄色葡萄球菌、草绿色链球菌、炭疽杆菌、表皮葡萄球菌、白喉杆菌及肠球菌等均有较强的抗菌作用。肌注本品血药浓度较等剂量头孢噻吩高2倍，持续时间亦较久。

【临床应用】临床适用于肺炎球菌及溶血性链球菌性脑膜炎、急性心内膜炎、骨髓炎、呼吸系统感染、皮肤软组织感染。可单独或合并用药，如与头孢噻吩合用治疗金黄色葡萄球菌性骨髓炎，效果比其他常规治疗为佳。对革兰阴性菌如大肠杆菌、淋球菌、脑膜炎双球菌、伤寒杆菌、变形杆菌等引起的感染，本品不是首选药。

【用法用量】肌注或静注：对革兰阳性菌所致的轻、中度感染和尿路感染：成人常用量为0.5～1g/次，2/d。儿童20～40mg/(kg·d)，分次给予。革兰阴性细菌和重度阳性菌感染：成人可加大至4g/d，儿童40～60mg/(kg·d)。连续应用不宜超过6d。

【不良反应】不良反应有瘙痒、荨麻疹、皮疹、恶心、呕吐。与青霉素之间偶有交叉过敏反应，在治疗过程中可发生二重感染（绿脓杆菌引起）、注射区疼痛等。

【注意事项】肾脏毒性比头孢噻吩大，总剂量在4g/d以上时即可引起肾脏毒性，但为可逆性，停

药可以恢复。每日用量不宜超过 4g。肾功能减退及尿素氮升高的病人慎用或适当减量。避免与呋喃苯胺酸、利尿酸和氨基糖苷类抗生素并用,以防止加重肾损害。用药前应做皮肤过敏试验。注射液需新鲜配制,防止析出结晶。

头 孢 来 星
Cefaloglycine

【别名】先锋Ⅲ,头孢甘酸,Cephaloglycin

【化学名称】 7-(D-α-氨基苯乙酰氨基)头孢烷酸

【化学分子式】 $C_{18}H_{19}N_3O_6S$

【剂型、性状】胶囊剂:含相当 250mg 本品无水物。白色或近于白色的结晶性粉末,以无水物为基础计算,每毫克中含本品不得低于 900μg,微溶于水,实际不溶于大多数有机溶剂。5%水混悬液。

【药理作用】抗菌谱与头孢氨苄(Cephalexin)相似,但对革兰阳性菌的作用稍强于头孢氨苄。

【体内过程】仅部分从胃肠道吸收,产生低血浆浓度,剂量 0.5~1g 时,峰值每毫升为 0.5~2μg,约 25% 随尿排出,主要以脱乙酰 Cephaloglycin 形式排出。剂量 250 和 500mg,8h 后尿中浓度为 200 和 350μg 服用 500mg 尿中最高浓度可达每毫升 1.3mg 以上,血浆蛋白结合率很少。

【临床应用】主要用于敏感菌所致的尿道感染,由于它不能产生所需的高血浆浓度用于治疗系统内感染,临床上现在较少应用。

【用法用量】 4/d,每次 250~500mg,儿童 25~50mg/(kg·d),分次服用。

【不良反应】与 Cephalexin 相当,可发生胃肠道副反应,腹泻发生率约为患者的 5%,恶心、呕吐也可发生,腹痛、胃肠道出血、肠炎也有报道。

【注意事项】参考头孢氨苄。

头 孢 氨 苄
Cefalexin

【别名】头孢力新,苯甘孢霉素,先锋霉素Ⅳ,Cephalexin,CEX

【化学名称】 (6R,7R)-3-甲基-7-[(R)-2-氨基-2-苯乙酰氨基],头孢烷酸

【化学分子式】 $C_{16}H_{17}N_3O_4S \cdot H_2O$

【剂型、性状】片(胶囊)剂:125mg,250mg;颗粒剂:1g 中含 50mg。为白色或近白色结晶性粉末,本品 1.05g 相当于无水物 1g。本品 1g 可溶于 100ml 水中,不溶于醇、氯仿和乙醚。英国药典规定 0.5% 水溶液的 pH 为 4.0~5.5。美国药典规定 5% 水混悬液的 pH 为 3.0~5.5。于 30℃以下避光贮存。

【药理作用】本品是 β-内酰胺抗生素,为合成的第一代口服头孢菌素,作用与青霉素相似,抑制细菌细胞壁的合成,是杀菌剂,主要抗革兰阳性球菌,抗某些革兰阴性菌有中等活性。敏感的阳性球菌有产酶与不产酶的葡萄球菌,许多链球菌、卡他球菌和奈瑟菌属是敏感的,但是耐青霉素的肺炎球菌和肠球菌耐药。本药对某些革兰阳性厌氧菌也敏感,对李斯特菌无效;对阴性菌如大肠杆菌、克雷伯杆菌(肺炎杆菌)、奇异变形杆菌、沙门菌和志贺菌属有抗菌作用,对肠杆菌属、吲哚阳性变形菌、粘质沙雷菌无抗菌作用。流感嗜血杆菌改变了对头孢氨苄的敏感性。

【体内过程】 本品在胃肠道几乎完全被吸收,口服 500mg,1h 后血药峰浓度为 18μg/ml,给予 2 倍剂量可达到双倍的血药浓度。如果本品与食物同时摄入,会延缓吸收,其吸收总量是不变的。血浆蛋白结合率为 15%,血浆 $t_{1/2}$ 为 1h,肾功能不全时 $t_{1/2}$ 延长。本品广泛分布于体内,但不能进入脑脊液能透过胎盘,乳汁中可见少量。本品不被代谢,于第一个 6h 经肾小球滤过和肾小管排泄,80% 以上药物以原型从尿中排泄,口服 500mg 后,尿中浓度达到 1mg/ml 以上。丙磺舒可延缓尿排泄,在胆汁和某些可排泄的途径中仍存在治疗有效浓度。本品可经血液透析和腹膜透析消除。

【临床应用】经口服治疗由敏感菌引起的胆道、呼吸道、尿道和皮肤软组织感染,严重感染宜选注射用头孢菌素。

【用法用量】 经口服给药治疗敏感菌感染,成人剂量每日服 1~2g,分 2~4 次服,每 6、8 或 12h 一次。严重或深部感染宜用注射用头孢菌素。儿童剂量每日给 25~100mg/kg 分次服。每日最大剂量为 4g。对青霉素过敏和过敏体质者慎用(对青霉素过敏患者约有 10% 对头孢菌素也会发生过敏反应)。

【不良反应】常见胃肠道功能紊乱,过敏反应如皮疹、荨麻疹、嗜酸细胞增多、发热、类血清疾病反应,偶见伪膜性结肠炎。

【注意事项】①肾功能严重损害者应酌情减量。②能降低含雌激素口服避孕药的效力。③急性卟啉症患者用头孢氨苄是不安全的,应慎重(实验表明其具有卟啉基因性)。对青霉素过敏或过敏体质者慎用。

头孢羟氨苄
Cefadroxil

【别名】羟氨苄头孢菌素，BL-S578，CDX，Cefadroxil monohydrate，Ultracef

【化学名称】7-[[2-氨基-(4-羟苯基)乙酰基]氨基]-3-甲基 8-氧代-5-硫杂-1-氮杂双环[4,2,0]-2-辛烯-2-羧酸

【化学分子式】$C_{16}H_{17}N_3O_5S$

【剂型、性状】胶囊剂 125mg，250mg，白色或类白色结晶性粉末，微溶于水，不溶于氯仿和乙醚。遇酸稳定。

【药理作用】本品为可口服半合成头孢菌素，在胃肠道吸收迅速而完全，不受食物影响，服药后 1.2h 左右达血清最高浓度。口服等剂量药物后，本品的血清浓度比头孢氨苄、头孢瑞丁高而持久。本品对 β-内酰胺酶较稳定。对本品敏感的细菌有：葡萄球菌、肺炎球菌β-溶血性链球菌、痢疾杆菌、沙门菌、大肠杆菌、奇异变形杆菌、流感嗜血杆菌、克雷伯杆菌及产生青霉素酶的细菌。

【临床应用】本品适用于上述敏感细菌感染。如呼吸系统感染、泌尿生殖系感染。此外亦用于急性化脓性扁桃体炎、扁桃体周围脓肿、乳突炎、鼻窦炎、痢疾、皮肤及软组织感染等。对骨髓炎、化脓性脑膜炎也有良效。

【用法用量】口服成人 2g/d，严重感染 3～4g/d，分 2 次服。儿童 50mg/(kg·d)，严重感染 75～100mg/(kg·d)，分 2 次服。咽炎常需用药 2 周。肾功能不全者，应适当延长给药间隔，肌酐清除率超过 50ml/min 者可正常治疗。

【不良反应】本品无严重不良反应。副作用轻而短暂，一般不需停药。主要副作用有皮疹、恶心、头晕、胃部不适，个别病例有转氨酶升高。最好在空腹时服药，如遇有胃肠道刺激严重，也可考虑饭后服用。

【注意事项】偶可致过敏，对其他头孢菌素过敏者忌用。

头 孢 拉 定
Cefradine

【别名】头孢环已烯，先锋霉素 VI，头孢雷定，环已烯头孢菌素，菌必清，Cephradine Velosef vial，Cefran.CED

【化学名称】7-[D-2-(1,4-环己二烯)-乙酰胺基]-3-甲基头孢烷酸

【化学分子式】$C_{16}H_{19}N_3O_4S$

【剂型、性状】胶囊剂：125mg，250mg 注射剂：分别为添加碳酸钠或精氨酸两种，每支含 0.5g 或 1.0g。白色或乳白色结晶性粉末，微溶于水，溶于甲醇(1：70)，易溶于丙二醇，不溶于乙醇，氯仿或乙醚。1% 水溶液 pH = 3.5～6.0。市售注射剂分别含有碳酸钠或精氨酸的中性制剂。含碳酸钠的注射剂与复方乳酸钠注射液禁忌，因后者含有钙盐。宜于 30℃以下避光贮存。

【药理作用】抗菌作用类似于头孢氨苄，对葡萄球菌(产酶或不产酶的)，许多链球菌(溶血性链球菌、对青霉素敏感的肺炎球菌等)、大肠杆菌、克雷伯杆菌、奇异变形杆菌、沙门、志贺菌属和某些阳性厌氧菌等有抗菌作用。

【体内过程】本品能迅速而安全地自胃肠道吸收，口服 250mg、500mg、1000mg 后 1h 的血药峰浓度分别是 9μg/ml、17μg/ml、24μg/ml，有食物存在时，会延缓吸收，但吸收总量不变。给予肌肉注射 500mg 或 1000mg，在 1～2h 内达到的血药峰浓度分别是 6μg/ml 和 14μg/ml，血浆蛋白结合率为 6%～20%。血浆 $t_{1/2}$ 约 1h，肾功能不全时会延长。可广泛分布于组织和体液中，但在脑脊液中不能达到有效量，胆汁中可见治疗浓度，能通过胎盘进入胎儿循环，在乳汁中排泌少量。在肾中经肾小球滤过和肾小管分泌排泌以原型排泄于尿中，肌肉注射后 6h 内尿中排出量为给药剂量的 60%～80%，口服或静脉注射后 6h 内尿中排出量为给药量的 90% 以上；口服 500mg 后尿中峰浓度达到 3mg/ml，丙磺舒延缓排泄。头孢拉定可由血液透析和腹膜透析消除。

【临床应用】头孢拉定是第一代头孢菌素，用于治疗金葡菌、表皮葡萄球菌、链球菌属、大肠杆菌等敏感菌所致的呼吸道感染、生殖泌尿道感染、皮肤组织感染等，效果满意。并作为预防手术后感染使用较广的药物之一。

【用法用量】口服每日给药 1～2g，分 2～4 次服，每日最大用量为 4g 严重感染必须注射给药，每日给予 2～4g，分 4 次经深部肌肉注射或缓慢静脉注射(3～5min 以上)或是静脉点滴，每日最高用量为 8g。儿童剂量口服每日给予 25～50mg/kg，注射剂每日给予 50～100mg/kg，严重感染每日可增至 300mg/kg。外科手术预防感染可于术前肌肉注射或静脉注射 1～2g，此后给予适当的注射或口服剂量。肾功能不全的患者，推荐成年人的负荷剂量为

750mg,维持量为 500mg。给药的时间间隔视肌酐清除率，>20ml/min 时为 6～12h;15～19ml/min 时为 12～24h;10～14ml/min 时为 24～40h;5～9ml/min 时为 40～50h;<5ml/min 时为 50～70h。

【不良反应】 常见胃肠道功能紊乱、皮疹、荨麻疹、嗜酸性细胞增多、发热、类血清疾病反应,偶见伪膜性结肠炎。

【注意事项】①肌肉注射后局部疼痛，静脉注射可致血栓静脉炎。②急性卟啉症患者用头孢拉定是不安全的，应慎重（实验表明头孢拉定具有卟啉基因性）。③对青霉素过敏和过敏体质者慎用（对青霉素敏感者约有 10% 对头孢菌素也会发生过敏反应)。

头 孢 唑 啉
Cefazolin

【别名】先锋霉素 V,唑啉头孢菌素,Cephazolin,Kefzol,CEZ

【化学名称】 (6R,7R)-3-[[(5-甲基-1,3,4-噻二唑乙基）硫]甲基]-7-[(1H- 四唑-1-基)]乙酰氨基]-头孢烷酸

【化学分子式】 $C_{14}H_{14}N_8O_4S_3$

【剂型、性状】注射用头孢唑啉钠每瓶 0.5g,1g。常用其钠盐，为白色或类白色结晶性粉末，无臭,味苦。钠盐 1.05g 相当于游离头孢唑啉 1g,每 1g 钠盐含有 2.1mmol 钠。易溶于水、0.9% 氯化钠溶液和葡萄糖溶液中，极微溶于乙醇，不溶于乙醚和氯仿,10% 水溶液的 pH=4.5～6.0。钠盐与氨基糖苷类和许多其他药物禁忌。当溶液的 pH 超过 8.5 时即可水解,若 pH 低于 4.5 时可析出头孢唑啉沉淀。钠盐 1g 与 0.9% 氯化钠注射液 2.5ml 组合一起有结晶形成，加温可重复溶解，因此可用 0.9% 氯化钠注射液做溶媒。

【药理作用】抗菌谱类似头孢噻吩,对葡萄球菌(包括产酶株)、链球菌(肠球菌除外)、肺炎球菌、大肠杆菌、奇异变形杆菌、克雷伯杆菌、流感嗜血杆菌等有抗菌作用。阳性球菌的 MIC 是 0.1～1.0μg/ml，对敏感的阴性杆菌的浓度需 >1μg/ml。

【体内过程】钠盐不被胃肠道吸收，宜肌肉或静脉注射,肌肉注射 500mg 后 1～2h 血药峰浓度是 30μg/ml 以上，血浆蛋白结合率为 85%，$t_{1/2}$ 为 1.8h，肾功能不全时 $t_{1/2}$ 会延长,当 Clcr<20ml/min 时,$t_{1/2}$ 延长至 12h。能扩散进入骨骼、腹膜、胸膜和滑膜液中,但不能透人脑脊液中,可透过胎盘进入胎儿循环中，乳汁中只排泌少量。肌肉注射后 24h 内自尿中排泄原型药物至少为 80%,肌肉注射 500mg 和 1000mg 后,尿药的峰浓度分别大于 1 和 4mg/ml,丙磺舒可延缓排泄。本品经胆汁排泄少量。起效时间为 15～30min,持续 6～8h。

【临床应用】头孢唑啉钠是第一代头孢菌素，用于治疗由敏感菌所致的各种感染，包括有胆道感染,心内膜炎(葡萄球菌),子宫内膜炎,剖宫产预防手术感染,腹膜炎,以及呼吸道、泌尿生殖器、骨、关节、皮肤软组织感染等。

【用法用量】供深部肌肉注射，缓慢静脉注射（3～5min 以上）或静脉点滴。成人用量为每 6～12h 给予 0.5～1.0g,每日最大剂量为 6g,严重致命性感染可用到 12g。儿童剂量:1 个月以上每日给 25～50mg，分次给，严重感染每日可用至 100mg/kg。手术期间感染的预防，手术前 0.5～1h 给予 1g 手术时间长时,可在术间再给 0.5～1.0g,术后 24h 内每 6～8h 给予 0.5～1.0g,某些病例可给至 5d 量。肾功能不全者，成人肌酐清除率为 55ml/min 以上者给常用量 清除率 35～54ml/min 给常用量，时间间隔至少 8h 清除率 11～34ml/min 每 12h 给常用量的 1/2;清除率为 10ml/min 或以下者,每 18～24h 给常用量的 1/2 其他，可做腹膜透析和眼内注射给药。已有以头孢唑啉钠与低溶的头孢唑啉二苄胺盐按 1∶4 的比例制成恒速释放剂型做肌肉注射。

【不良反应】偶见皮疹、荨麻疹、嗜伊红细胞增多、发热、类血清疾病反应,静脉注射后可出现静脉炎，肌肉注射出现疼痛。

【注意事项】①静脉注射后可引起静脉炎，肌肉注射后局部疼痛，但发生率较低 ②青霉素过敏和过敏体质者慎用 ③少数病人可致转氨酶升高、尿素氮升高和蛋白尿、白细胞或血小板减少、抗人球蛋白试验阳性 ④供肌肉注射的制剂不可注入静脉。

头 孢 乙 氰 钠
cefacetrile

【别名】头孢乙氰，先锋Ⅶ,头孢氰甲,Cefacetrin Sodium,Celospor

【化学名称】 3-[(乙酰氧基)甲基]-7-[(氰乙酰基]氨基]-8-氧代-5-硫杂-1-氮杂二环[4,2,0]-2-辛烯-2-羧酸

【化学分子式】 $C_{13}H_{13}N_3O_6S$

【剂型、性状】粉针剂:1g。药用为钠盐，白色结晶性粉末，易溶于水。

【药理作用】 为第一代头孢菌素，抗菌谱和头孢噻吩、头孢噻啶相似，但对大肠杆菌的抗菌作用比头孢噻吩强 5～10 倍。对大肠杆菌、产气杆菌等产生的 β-内酰胺酶特别稳定，比头孢噻啶大 10 倍。主要由肾排出。

【体内过程】本品极少从胃肠道吸收，肌肉注射 1g，1h 内血浆浓度为 13～23μg/ml，血浆蛋白结合率为 30%～40%，能通过肾小球滤过和肾小管分泌后主要随尿排出，25% 以上以脱乙酰方式代谢，肌肉注射量的 70% 在 6h 内排出，尿中含量为 3mg/ml。

【临床应用】临床用于肾盂肾炎、尿路感染、呼吸道感染等。

【用法用量】静注：成人轻症 2～6g/d，重症 6～12g/d，分 2～4 次。以本品 1g 溶于 100ml 生理盐水中缓慢静注(至少 3min)。

【不良反应】对肝、肾毒性较小，不良反应为少数病例有荨麻疹、胃肠道反应，静脉注射有血栓性静脉炎等。肌注疼痛较剧。

【注意事项】肾功能不全者慎用。

头孢匹林钠
Cefapirin Sodium

【别名】头孢菌素Ⅷ，先锋Ⅷ，头孢吡硫，Cephapirin，Brisfirina，Cefadal

【化学名称】 3-[(乙酰氧基)甲基]-8-氧代-7-[[(4-吡啶基硫)乙酰基]氨基]-5-硫杂-1-氮杂二环[4,2,0]-2-辛烯-2-羧酸

【化学分子式】 $C_{17}H_{17}N_3O_6S_2$

【剂型、性状】 注射剂：0.5g、1g。钠盐为无色结晶性粉末，易溶于水，微溶于乙醇，在乙醚、氯仿中极微溶解，每 1.05g 相当于游离酸 1g。

【药理作用】为第一代头孢菌素。抗菌谱与头孢噻吩相似，对许多革兰阳性菌和一些革兰阴性菌有效，对肺炎球菌较突出。

【体内过程】肌注半衰期仅 20min，4h 后基本清除。

【临床应用】作用与头孢噻吩相近。

【用法用量】 2～6g/d，重症可用到 12g，分 2～4 次肌注或静注，也可静滴。

【不良反应】本品刺激性轻，注射疼痛及局部反应轻。其他参见头孢噻吩。

【注意事项】对青霉素过敏者慎用，不可与甘露醇、多粘菌素、氨基糖苷类配伍，因可产生混浊。

头 孢 呋 辛
Cefuroxime

【别名】头孢呋肟，西力欣， Zinacef，Zinnat，CXM

【化学名称】 7-[2-(甲氧亚氨基-呋喃基-2)乙酰胺]-3-氨甲酰氧甲基-头孢烷酸

【化学分子式】 $C_{16}H_{16}N_4O_8S$

【剂型、性状】粉针剂：0.75g，1.5g。常用其钠盐，头孢呋辛钠 1.05g，相当于头孢呋辛 1g，每克钠盐含约 2.2mmol 钠。为白色或微黄色结晶性粉末，易溶于水，其 10% 水溶液的 pH 为 6.0～8.5。其酯化制剂称新菌灵。

【药理作用】头孢呋辛为半合成的第二代头孢菌素，是杀菌剂，对革兰阳性葡萄球菌和链球菌的抗菌作用与头孢噻吩相似或较弱，而对革兰阴性菌产生的某些 β-内酰胺酶能耐受，其对大肠、克雷伯、沙门和吲哚阳性变形杆菌属的作用比头孢噻吩强。对产酶的流感嗜血杆菌、奈瑟淋球菌比头孢孟多更有效，然而用高于最低杀菌浓度的头孢呋辛治疗流感嗜血杆菌脑炎也有出现失败之例。有报道降低 PBP 对头孢呋辛的亲和力以耐受流感嗜血杆菌的 β-内酰胺酶。

【体内过程】供肌肉或静脉注射，肌肉注射 750mg45min 后血药峰浓度约为 27μg/ml，在给药 8h 后仍可测到有效浓度。血浆蛋白结合率约为 50% 以上。$t_{1/2}$ 为 70min，肾损害患者和新生儿的 $t_{1/2}$ 会相对延长。头孢呋辛在体内分布广泛，如胸膜液、痰、骨、滑膜液和体液中，当脑膜炎时透过脑脊髓液可达到治疗浓度，可透过胎盘和出现于乳汁中。注射后 24h 内以原型从尿中排出大部分，主要在 6h 内。与丙磺舒共用可提高血药浓度，从胆汁中排出少量。透析可减低浓度。

【临床应用】头孢呋辛是第二代头孢菌素，用于治疗敏感菌所致的骨和关节感染、支气管炎和其他下呼吸道感染、淋病、脑膜炎（流感嗜血杆菌所致脑膜炎无效）、中耳炎、腹膜炎、咽炎、鼻窦炎、皮肤软组织感染、外科感染的预防和尿道感染。

【用法用量】头孢呋辛钠供深部肌肉注射，缓慢静脉注射(3～5min 以上)，或静脉点滴给药。常用剂量为每 8h 给 750mg，严重感染每 8 或 6h 静脉给 1.5g；婴儿和儿童每日给 30～60mg/kg，需要时可每日给 100mg/kg，分 3～4 次给予，新生儿可给予相似的日剂量，宜分为 2～3 次。肾功能不全者宜减

少给药剂量，当肌酐清除率为 10～20ml/min 时，给750mg,2/d，当清除率在 10ml/min 以下时，给750mg,1/d。治疗敏感菌所致的脑膜炎时，每 8h 静脉给予 3g;婴儿和儿童每天静脉给予 200～240mg/kg,分 3～4 次给予，3d后或临床症状有改善时，剂量可减至 100mg/(kg·d)；对新生儿的剂量为100mg/(kg·d)。缓解时推荐减至 50mg/(kg·d)。治疗淋病给予一个单剂量肌肉注射 1.5g(分成 2 个注射部位)；对非难治性淋病可口服头孢呋辛 1g 和丙磺舒 1g。手术预防感染的常用量，在手术前静脉注入 1.5g,之后每 8h 静注或肌肉注射 750mg,连续用24～48h 对置换关节可用头孢呋辛粉 1.5g 与甲基丙烯酸甲酯水门汀混合。

【不良反应】 可有过敏反应，如皮疹、荨麻疹、嗜酸性细胞增多、药物热、类血清疾病反应；多形性红斑、stevens-Johnson 综合征和毒性皮肤坏死较罕见。

【注意事项】急性卟啉症患者用头孢呋辛不安全,应慎重与高效利尿剂(如呋塞米)联合应用，可致肾损害。对青霉素类和其他头孢菌素类过敏者慎用。

头孢呋辛乙酰氧乙酯
Cefuroxime Axetil

【别名】新菌灵,CXM-AX

【化学名称】 7-[(2-(甲氧亚氨-呋喃基-2)乙酰胺]-3-氨甲酰氧甲基-头孢烷酸的乙酰氧乙酯

【化学分子式】 $C_{20}H_{22}N_4O_{10}S$

【剂型、性状】片剂:125mg,250mg,500mg。为白色或灰白色粉末,味苦,脂溶性强,口服吸收良好。

【药理作用】头孢呋辛乙酰氧乙酯的抗菌活性甚低,口服吸收后于 3～4min 内在肠粘膜和门脉循环中为非特异性酯酶迅速水解，释放出头孢呋辛而发挥其抗菌作用，因此头孢呋辛乙酰氧乙酯的抗菌谱和抗菌活性与头孢呋辛相同。

【体内过程】口服 500mg,2～3h 血药峰浓度达最高,餐后给药 8h 的血药浓度仍为流感嗜血杆菌和金葡菌 MIC 的 4 倍以上；空腹服药的生物利用度为 36%,进餐后可达 52% 血清 $t_{1/2}$ 为 1.2～1.6h ;空腹服 500mg 后,24h 尿中排泄量为给药量的 32%,餐后服药则为 48%。

【临床应用】适宜治疗由敏感菌引发的轻度或中度感染。如中耳炎、鼻窦炎、扁桃体炎、咽炎、急性和慢性支气管炎、肺炎、肾盂肾炎、膀胱炎、尿道炎、皮肤及软组织感染、淋病等。

【用法用量】成人剂量为 250mg,2/d;下呼吸道感染为 500mg,2/d;尿道感染为 125mg,2/d;肾盂肾炎为 250mg,2/d;单纯性淋病感染的单剂量为 1g。儿童剂量为 125mg,2/d,2 岁以上中耳炎患者为250mg,2/d。药片味苦，应吞服，不可嚼碎，因此不用于有吞服困难的患儿。一般疗程为 7d(5～10d)。餐后服药,可增加吸收,提高血药浓度,亦可减少胃肠道反应。

【不良反应】头孢呋辛乙酰氧乙酯的不良反应轻微而短暂，多不影响治疗，主要为胃肠道反应，如恶心、呕吐、腹泻等 变态反应与其他头孢菌素类相似,偶见伪膜性结肠炎、嗜酸粒细胞增多及一过性肝酶升高 曾有出现库姆试验阳性的报告,该现象会干扰血液的交叉配合。

【注意事项】①对青霉素类过敏的患者应慎用 ②长期服用头孢呋辛乙酰氧乙酯者，可能会引起不敏感菌过度生长，如念珠菌属、肠球菌属及难辨梭状芽胞杆菌，因而需要中断治疗;③用药过程中若出现严重腹泻，应考虑伪膜性结肠炎的诊断。对青霉素类和头孢菌素类过敏和特异体质者禁用。

头 孢 克 洛
Cefaclor

【别名】头孢克罗，头孢氯氨苄，希刻劳，Ceclor,Alfatil,CCL

【化学名称】 7-(D-2-氨基-苯乙酰胺基)-3-氯-头孢烷酸

【化学分子式】 $C_{15}H_{14}ClN_3O_4S \cdot H_2O$

【剂型、性状】胶囊剂 250mg。白色或类白色结晶性粉末，本品 1.05g 相当于无水物 1g 略溶于水(1: 100)，极微溶于氯仿、乙醚或甲醇中;2.5% 水混悬液的 pH 为 3.0～4.5,贮存于避光容器中,对胃酸稳定,遇碱逐渐分解。

【药理作用】头孢克洛是杀菌剂，抗菌作用与头孢氨苄相似,但是抗革兰阴性菌的作用更强,包括大肠杆菌、肺炎杆菌、淋球菌、奇异变形杆菌,尤其对流感嗜血杆菌等有很好的抗菌作用，对流感嗜血杆菌的某些产酶株也有效。体外试验证明对葡萄球菌青霉素酶比头孢氨苄和头孢拉定较少耐药。

【体内过程】头孢克洛在胃肠道易吸收，但达到的血浆浓度水平比头孢氨苄或头孢拉定稍低。口服 250mg和500mg 后 0.5～1h 血药峰浓度分别达到 6μg/ml 和 13μg/ml，有食物存在时可延缓头孢克

需要全本请访问 www.ertongbook.com