

核准日期：2006 年 10 月 16 日

修改日期： 年 月 日

注册商标

注射用头孢硫脒说明书

注册商标

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用

【药品名称】

通用名称：注射用头孢硫脒

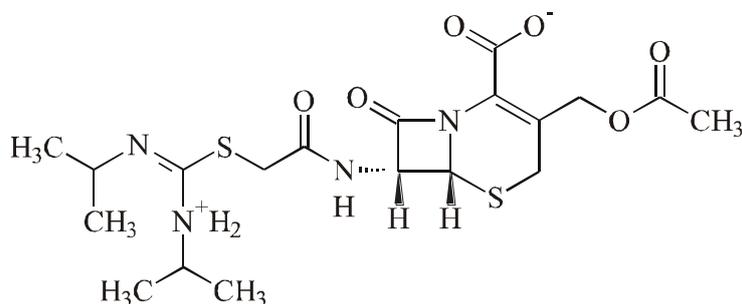
英文名称：Cefathiamidine for Injection

汉语拼音：Zhusheyong Toubaoliumi

【成份】本品主要成份为头孢硫脒。

化学名称：(6R, 7R)-3-[(乙酰氧基)甲基]-7-[α -(N, N-二异丙基脒硫基)乙酰氨基]-8-氧代-5-硫杂-1-氮杂双环[4.2.0]辛-2-烯-2-甲酸内铵盐。

化学结构式：



分子式：C₁₉H₂₈N₄O₆S₂

分子量：472.59

【性状】本品为白色至微黄色结晶性粉末。

【适应症】用于敏感菌所引起呼吸系统、肝胆系统、五官、尿路感染及心内膜炎、败血症。

【规格】0.5g

【用法用量】

肌肉注射：一次 0.5g~1.0g，一日 4 次；小儿按体重一日 50mg~100mg/kg，分 3~4 次给药。

静脉给药：一次 2g，一日 2~4 次；小儿按体重一日 50mg~100mg/kg，分 2~4 次给药。

临用前加灭菌注射用水或氯化钠注射液适量溶解。

【不良反应】偶有荨麻疹、哮喘、皮肤瘙痒，寒战高热、血管神经性水肿等，偶见治疗后非蛋白氮和谷丙转氨酶升高。

全身性损害：过敏性休克、过敏样反应、晕厥、乏力。

皮肤及其附件：皮疹、斑丘疹、红斑疹、血管性水肿、剥脱性皮炎。

呼吸系统：呼吸困难、胸闷、呼吸急促、喉水肿。

神经系统：头晕、头痛、抽搐、震颤、局部麻木。

胃肠系统：恶心、呕吐、腹痛、腹泻。

心血管系统：紫绀、心悸、心动过速、血压升高、血压下降。

肝胆系统：肝功能异常。

精神紊乱：意识模糊、精神障碍、嗜睡。

泌尿系统：肾功能异常、血尿

血液系统：白细胞减少、粒细胞减少。

其他：眼睑水肿、视觉异常、耳鸣、注射部位疼痛。

【禁忌】对头孢菌素类抗生素过敏者禁用。

【注意事项】

1. 交叉过敏反应：应用本品前须详细询问头孢菌素类及青霉素类的药物过敏史，对一

种头孢菌素或头霉素(cephamycin)过敏者对其他头孢菌素或头霉素也可能过敏。对青霉素类、青霉素衍生物或青霉胺过敏者也可能对头孢菌素或头霉素过敏。对青霉素过敏病人应用头孢菌素时发生过敏反应者达5%~7%;如做免疫反应测定时,则对青霉素过敏病人对头孢菌素过敏者达20%。

2. 对青霉素过敏病人应用本品时应根据病人情况充分权衡利弊后决定。有青霉素过敏性休克或即刻反应者,不宜再选用头孢菌素类。

3. 有胃肠道疾病史者,特别是溃疡性结肠炎、局限性肠炎或抗生素相关性结肠炎(头孢菌素类很少产生伪膜性结肠炎)者应慎用。

4. 肾功能减退病人应用本品须适当减量。

5. 对诊断的干扰:应用本品的病人抗球蛋白(Coombs)试验可出现阳性;孕妇产前应用本品,此阳性反应也可出现于新生儿。

6. 本品可发生过敏性休克,用药后出现过敏反应或其他严重不良反应须立即停药并及时救治。

7. 几乎所有抗生素包括头孢硫脒在使用时都有艰难梭菌性腹泻的报道,根据病情严重程度可能为轻度腹泻至致命性结肠炎。抗生素治疗改变了结肠的正常菌群,而导致艰难梭菌的过度生长。

8. 本品应即配即用,不宜长时间放置。

9. 本品应单独使用,不得与其他药物混合在同一容器内使用。

【孕妇及哺乳期妇女用药】怀孕早期应慎用。哺乳期妇女应用头孢菌素类虽未见发生问题的报道,其应用仍须权衡利弊。

【儿童用药】参照用法用量。

【老年用药】老年患者肾功能减退,应用时须适当减量。

【药物相互作用】本品肌内注射合用丙磺舒1g后,12小时尿排泄量降为给药量的65.7%。

【药物过量】未进行该项实验且无可靠参考文献。

【药理毒理】

1. 药理

本品对革兰阳性菌及部分阴性菌有抗菌活性,对革兰阳性球菌的作用尤强。本品体外抗菌活性试验表明:对肺炎球菌、化脓性链球菌、金黄色葡萄球菌(MSSA 菌株)、表皮葡萄球菌(MSSE 菌株)和卡他布兰汉菌有较强的抗菌活性,对肺炎链球菌 MIC₉₀ 为 0.25 μg/ml,对化脓性链球菌 MIC₉₀ 为 0.5 μg/ml,对其他3种细菌的 MIC₉₀ 均小于 8.0 μg/ml,对流感嗜血杆菌亦有较强的抗菌活性, MIC₉₀ 为 2.0 μg/ml。对肠球菌亦显示有很强的体外抗菌活性, MIC₉₀ 为 2.0 μg/ml。对草绿色链球菌、溶血性链球菌、非溶血性链球菌、白喉杆菌、产气荚膜杆菌、破伤风杆菌和炭疽杆菌均有良好抗菌作用。对金黄色葡萄球菌(MRSA 菌株)、表皮葡萄球菌(MRSE 菌株)的体外抗菌活性不如万古霉素。本品作用机制为抑制敏感菌的细胞壁合成,而产生杀菌作用。

2. 毒理

本品小鼠静脉注射的 LD₅₀ 为(1.02±0.04)g/kg,腹腔注射的 LD₅₀ 为(1.26±0.23)g/kg。生殖毒性试验中,试验组小鼠的胎仔死亡率明显高于对照组(p<0.01)。

【药代动力学】

本品口服不吸收,静脉滴注 1.0g 后,血药峰浓度(C_{max})为(68.93±6.86)mg/L,血消除半衰期(t_{1/2β})为(1.19±0.12)h,血药浓度-时间曲线下面积(AUC)为(94.7±9.8)mg·h/L,12小时尿药累计排泄率为 93.1±3.2%。肌内注射 1.0g 后,血药峰浓度(C_{max})为(35.12±4.34)mg/L,达峰时间(t_{max})为(0.78±0.08)h,半衰期为(1.38±0.21)h,血药浓度-时间曲线下面积(AUC)为(85.3±8.0)mg·h/L,12小时尿中药累计排泄率为 84.2±5.9%。与静脉滴注相比,其绝对生物利用度为 90.3±6.4%。本品注射后在体内组织分布广泛,以胆汁、肝、肺等处含量为高,不透过血-脑脊液屏障。在机体内几乎不代谢,主要从尿中排出,12

小时尿中排出给药量的 90% 以上。肾功能减退患者，肌内注射后血清半衰期延长至 13.2 小时，约为正常半衰期的 10 倍，24 小时尿中仅排出给药量的 3.2%，血液透析可排出给药量的 20%~30%。

【贮藏】 密封，在凉暗(避光并不超过 20℃)干燥处保存。

【包装】 管制抗生素瓶装，每小盒 1 瓶；

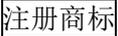
管制抗生素瓶装，每盒 10 瓶。

【有效期】 18 个月

【执行标准】 YBH02732016

【批准文号】 国药准字 H44024253

【生产企业】

企业名称： 广州白云山医药集团股份有限公司白云山制药总厂

生产地址：广州市白云区同和街云祥路 88 号

邮政编码：510515

质量服务电话：(020)87063679

销售服务电话：(020)87573176

传真号码：(020)87061075

网址：<http://www.byszc.com>