

核准日期: 2007年02月02日
修改日期: 2007年04月27日
2010年10月01日
2012年10月01日
2015年12月01日
2020年12月15日
2023年04月17日

注射用头孢他啶说明书

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: 注射用头孢他啶

英文名称: Cefprozime for Injection

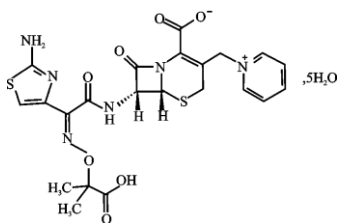
汉语拼音: Zhushheyong Toubaotading

【成份】

本品主要成份为头孢他啶。

化学名称: (6R, 7R) -7- [[(2-氨基-4-噻唑基) - [(1-羧基-1-甲基乙氧基) 亚氨基] 乙酰基] 氨基] -2-羧基-8-氧代-5-硫杂-1-氮杂双环 [4.2.0] 辛-2-烯-3-甲基吡啶鎓内盐五水合物

化学结构式:



分子式: $C_{22}H_{22}N_6O_7S_2 \cdot 5H_2O$

分子量: 636.65

辅料为: 无水碳酸钠

【性状】本品为白色或类白色结晶性粉末。

【适应症】

用于敏感革兰阴性杆菌所致的败血症、下呼吸道感染、腹腔和胆道感染、复杂性尿路感染和严重皮肤软组织感染等。对于由多种耐药革兰阴性杆菌引起的免疫缺陷者感染、医院内感染以及革兰阴性杆菌或铜绿假单胞菌所致中枢神经系统感染尤为适用。

【规格】

以 $C_{22}H_{22}N_6O_7S_2$ 计: (1) 0.5 g (2) 1.0 g (3) 1.5 g (4) 2.0 g

【用法用量】

静脉注射或静脉滴注。剂量依感染的严重程度、微生物敏感性及患者机体状态而定。

成人: 1、败血症、下呼吸道感染、胆道感染等, 一日 4~6g, 分 2~3 次静脉滴注或静脉注射, 疗程 10~14 日。

2、泌尿系统感染和重度皮肤软组织感染等, 一日 2~4g, 分 2 次静脉滴注或静脉注射, 疗程 7~14 日。对于轻度尿路感染, 每 12 小时 0.5~1g 即已足够。

3、对于某些危及生命的感染、严重铜绿假单胞菌感染和中枢神经系统感染, 可酌情增量至一日 0.15~0.2g/kg, 分 3 次静脉滴注或静脉注射。

儿童: 2 个月以上婴幼儿常用剂量为一日 30~100mg/kg, 分 2~3 次静脉滴注。对新生儿至 2 个月婴儿临床经验有限。

肾功能损害患者: 因头孢他啶主要经肾脏排泄, 对肾功能损害患者应减量使用。可根据肌酐清除率来计算合适的给药剂量。透析后患者应重复审定当维持剂量。

配制方法: 5ml 注射用水加入 0.5g 装瓶中或 10ml 注射用水加入 1g 或 2g 装瓶中, 使完全溶解后, 于 3~5 分钟静脉缓慢推注。也可将上述溶解后的药液 (含 1~2g) 用 5% 葡萄糖或氯化钠注射液 100 ml 稀释后静脉滴注 20~30 分钟。

【不良反应】

本品一般耐受性良好, 不良反应少见而轻微。主要有:

1、局部反应: 因静脉给药出现静脉炎或血栓性静脉炎, 肌肉注射有局部疼痛或发炎;

2、过敏反应: 少数患者可发生皮疹、荨麻疹、皮肤瘙痒、药物热和罕见的血管神经性水肿、支气管痉挛、低血压等。与其他头孢菌素一样, 曾有过敏性休克报道;

3、胃肠道反应: 恶心、呕吐、腹泻、腹痛和罕见的鹅口疮或结肠炎。与其他头孢菌素一样, 结肠炎可能与艰难梭状芽孢杆菌有关, 并可能会以伪膜性结肠炎出现;

4、中枢神经系统: 头痛、眩晕、感觉异常。曾有引起癫痫发作的报道。

5、临床检验结果的改变: 发生短暂性的血清氨基转移酶、乳酸脱氢酶、碱性磷酸酶、血尿素氮、血肌酐值的轻度升高; 白细胞、血小板减少及嗜酸性粒细胞增多、淋巴细胞增多等。

【禁忌】

对本品或其他头孢菌素类抗生素过敏者禁用。

【注意事项】

1、交叉过敏反应: 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素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%~10%。如作过敏试验, 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、所有广谱抗生素包括头孢他啶都有可能引起伪膜性结肠炎。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者应慎用。

4、尚未证明本品有肾毒性, 但对肾功能明显减退者在应用本品时, 需根据肾功能损害程度减量。

5、同其他抗生素一样, 长期使用本品可导致非敏感菌过度生长。应注意监察二重感染的发生并采取相应措施。

6、对重症革兰氏阳性球菌感染, 本品为非首选品种。

7、对诊断的干扰: 应用本品的病人直接抗球蛋白 (Coombs) 试验可出现阳性; 本品可使硫酸铜尿糖试验呈假阳性; 血清丙氨酸

氨基转移酶 (ALT)、门冬氨酸氨基转移酶 (AST)、碱性磷酸酶、血尿素氮和血清肌酐皆可升高。

8、以氯化钠注射液、5%葡萄糖注射液或乳酸钠注射液稀释成的静脉注射液 (20mg/ml) 在室温存放不宜超过 24 小时。

9、在不同存放条件下, 本品粉末的颜色可变暗, 但不影响其活性。

10、如溶解本品含碳酸钠的制剂时, 可形成二氧化碳使瓶内产生压力, 此时应排气。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

已在小鼠和大鼠中以高达 40 倍的人用剂量进行了生殖毒性试验, 未见对生育力和胚胎的影响。因为动物不能完全预测人体反应, 妊娠期妇女应用仍须权衡利弊。本品可分泌至乳汁中, 哺乳期妇女使用本品应谨慎。

【儿童用药】

小儿一日最高剂量不超过 6g。

【老年用药】

65 岁以上的老年患者剂量可减少至正常剂量的 2/3~1/2, 一日最高剂量不超过 3g。

【药物相互作用】

1、本品与下列药物有配伍禁忌: 硫酸阿米卡星、庆大霉素、卡那霉素、妥布霉素、新霉素、盐酸金霉素、盐酸四环素、盐酸土霉素、粘菌素甲磺酸钠、硫酸多粘菌素 B、葡萄糖酸红霉素、乳酸红霉素、林可霉素、磺胺异噁唑、氨茶碱、可溶性巴比妥类、氯化钙、葡萄糖酸钙、盐酸苯海拉明和其他抗组胺药、利多卡因、去甲肾上腺素、间羟胺、哌甲酯、琥珀胆碱等。偶亦可能与下列药物发生配伍禁忌: 青霉素、甲氧西林、琥珀酸氢化可的松、茶妥英钠、丙氯拉唑、维生素 B 族和维生素 C、水解蛋白。

2、在碳酸氢钠溶液中的稳定性较在其他溶液中为差。

3、本品不可与氨基糖苷类抗生素在同一容器中给药。与万古霉素混合可发生沉淀。

4、本品与氨基糖苷类抗生素或速尿等强利尿剂合用时需严密观察肾功能情况, 以避免肾损害的发生。

【药物过量】

肾衰竭患者发生过头孢他啶药物过量, 反应包括癫痫发作、脑病、扑翼样震颤、神经肌肉的兴奋。对急性药物过量的病人应仔细观察, 并给予对症支持疗法。对肾功能不足的病人, 给予血液透析或腹膜透析可能有助于将头孢他啶排出体外。

【药理毒理】

头孢他啶为第三代头孢菌素类抗生素。抗菌谱广, 对多数革兰阳性菌和阴性菌有效。对大肠埃希菌、肺炎杆菌等肠杆菌科细菌和流感嗜血杆菌、铜绿假单胞菌等有高度抗菌活性。对硝酸盐阴性杆菌、产碱杆菌等亦有良好抗菌作用。对于细菌产生的大多数 β -内酰胺酶高度稳定, 故其对上述革兰氏阴性杆菌中多重耐药株仍可具抗菌活性。肺炎球菌、溶血性链球菌等革兰氏阳性球菌对本品高度敏感。但本品对葡萄球菌仅具中度活性, 肠球菌和耐甲氧西林葡萄球菌则往往对本品耐药。本品对消化球菌和消化链球菌等厌氧菌具一定抗菌活性, 但对脆弱拟杆菌抗菌作用差。

本品为杀菌药。其作用机制为与细菌细胞膜上的青霉素结合蛋白 (PBPs) 结合, 使转肽酶酰化, 影响细胞壁粘肽成分的交叉连结, 抑制细菌细胞壁的合成, 使细胞分裂和生长受到抑制, 最后溶解和死亡。

【药代动力学】

成人单次静脉滴注和静脉注射头孢他啶 1g 后, 血药峰浓度 (C_{max}) 分别可达 70~72mg/L 和 120~146mg/L。血液药物消除半衰期 ($t_{1/2\beta}$) 约为 1.5~2.3 小时。给药后在骨、心、胆汁、痰、眼房水、滑膜液、胸膜液及腹膜液等多种组织和体液中分布良好, 易透过胎盘, 少量可透过血-脑脊液屏障, 脑膜有炎症时, 脑脊液内药物浓度可达同期血浓度的 17%~30%。血浆蛋白结合率低, 约为 5%~23%。

本品不经过代谢, 主要以原形自肾小球滤过排出, 静脉给药后 24 小时内以原形自尿中排出给药量的 84%~87%, 胆汁中排出量少于给药量的 1%。

中、重度肾功能损害者本品的消除半衰期延长, 当内生肌酐清除率 $\leq 2\text{ml/分钟}$ 时, 消除半衰期可延长至 14~30 小时。在新生儿中的半衰期稍延长 (平均 4~5 小时)。本品可通过血液透析清除。

【贮藏】

密封, 在凉暗处 (避光并不超过 20°C) 保存。

【包装】

西林瓶装, 1 瓶/盒; 10 瓶/盒。

【有效期】 24 个月

【执行标准】

《中国药典》2020 年版二部

【批准文号】

0.5 g/瓶 国药准字 H20033084;

1.0 g/瓶 国药准字 H20023271;

1.5 g/瓶 国药准字 H20034135;

2.0 g/瓶 国药准字 H20034136。

【上市许可持有人】

名称: 苏州东瑞制药有限公司

地址: 江苏省苏州吴中经济开发区民丰路 268 号

邮政编码: 215124

电话号码: 0512-65626868

传真号码: 0512-65628688

网址: www.dawnrays.com

产品咨询热线: 400 030 9000

【生产企业】

企业名称: 苏州东瑞制药有限公司

生产地址: 江苏省苏州吴中经济开发区善丰路 99 号

电话号码: 0512-65626969

传真号码: 0512-65628688