

4. 其他注意事项

【孕妇及哺乳期妇女用药】孕妇或可能妊娠的妇女，仅在治疗的有益性超过危险性时方可给药(尚未确立妊娠期用药的安全性)。

【儿童用药】早产，新生儿慎用，其他详见【用法用量】项。

【老年用药】对老年患者，应在注意以下因素的同时，考虑用量和给药间隔等因素，慎重给药。

(1)老年患者因生理机能降低，易发生不良反应。

(2)老年患者因维生素K缺乏可能引起出血倾向。

【药物相互作用】

合并用药时应注意：

药物名称	临床症状及处理方法	机理及危险因素
酒精	饮酒会出现双硫仑样作用（颜面潮红、心悸、眩晕、头痛、欲吐等）[给药期间及给药后至少1周避免饮酒]。	虽不明确，但3位侧链的N-甲硫四唑基可能有双硫仑样作用。
利尿剂（呋塞米等）	有可能增强肾损害。	虽不明机理，但据报道，动物实验（大鼠）合用呋塞米，见到轻度至中度的近端肾小管上皮细胞核萎缩及浓缩。

【药物过量】尚不明确。

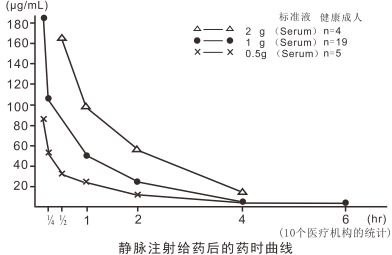
【临床药理】

药代动力学

1.血药浓度

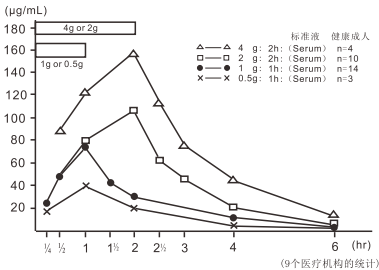
(1)静脉注射

健康成人静脉注射头孢美唑钠1g(按C₁₅H₁₇N₇O₅S₃计算)时，给药10分钟后的平均血药浓度为188 μg/ml，6小时后为1.9 μg/ml，血浆半衰期为1小时左右，血药浓度和给药剂量呈相关性。



(2)静脉滴注

健康成人静脉滴注头孢美唑钠1g(按C₁₅H₁₇N₇O₅S₃计算)1小时，血药浓度在滴注结束时达峰值，平均值为76.2 μg/ml，6小时后为2.7 μg/ml，血浆半衰期为1.2小时左右，血药浓度和给药剂量呈相关性。



2.血清蛋白结合率

头孢美唑钠100 μg/ml：84.8%

头孢美唑钠25 μg/ml：83.6%

(体外，离心超滤法)

3.分布

高浓度分布于痰液、腹水、腹腔渗出液、胆囊壁、胆汁、子宫/卵巢/输卵管、盆腔积液、颌骨、上颌窦粘膜、牙龈等。另外，也分布于羊水、脐带血、肾（皮质及髓质），但几乎不分布于母乳中。

4.代谢及排泄

头孢美唑钠在体内不代谢，大部分以具有抗菌活性的原型状态从尿中排泄。6小时内尿中回收率为85~92%，代谢率高。

5.肾功能损害时的血中浓度及尿中排泄

肾功能降低时，尿中排泄减少，出现血药浓度上升及半衰期延长。

6.肾功能损害患者用药

肾功能损害患者静脉滴注头孢美唑钠1g（按C₁₅H₁₇N₇O₅S₃计算），用一室开放模型解析药代动力学，结果显示肾功能与头孢美唑钠的血清除率及肾清除率之间有显著相关性。

	Ccr 范围 (ml/min)	Ccr (ml/min)	Sc1 (ml/min)	Rc1 (ml/min)
健康成人组	>90	115.8±7.4	160.8±2.9	110.6±14.9
肾功能损害患者组	60~90	76.1±2.8	69.4±7.0	41.9±3.8
	30~60	43.8±4.9	40.9±8.6	29.9±5.1
	10~30	17.1±2.3	26.9±7.0	12.1±3.7
	<10	4.4±1.9	11.2±3.9	3.9±2.8

头孢美唑钠的临床结果表明，1次给药1g，1日2次，每12小时给药一次的方法为最多，且有效率高。以该方法给药时，肾功能损害患者的给药剂量与给药间隔之间的关系见下表。

Ccr (ml/min)	调节给药间隔		调节用量	
	用量 (mg)	给药间隔(h)	用量 (mg)	给药间隔 (h)
>60	1000	12	1000	12
60~30	1000	24	500	12
30~10	1000	48	250	12
<10	1000	120	100	12

【药理毒理】

药理作用

1、抗菌作用

(1)头孢美唑钠对β-内酰胺酶高度稳定，对产β-内酰胺酶以及不产β-内酰胺酶的敏感菌具有相同的强的抗菌活性。

(2)对金黄色葡萄球菌、大肠埃希菌、肺炎杆菌、奇异变形杆菌有良好的抗菌作用，而且对耐头孢菌素类及耐青霉素类抗生素的普通变形杆菌、摩氏摩根菌、普罗威登斯菌属也有很强的抗菌活性。另外，对消化链球菌及拟杆菌属、普雷沃菌属（双路普雷沃菌除外）等厌氧菌也显示出很强的抗菌作用。

2、作用机理

通过抑制增殖期细菌的细胞壁合成，而发挥杀菌作用。

毒理研究

1.幼年大鼠皮下给药实验，有睾丸萎缩、抑制精子形成作用。

2.用小鼠、家兔、豚鼠探讨了头孢美唑钠的抗原性，其结果与其它头孢菌素类抗生素相同，所有动物的抗原性均较弱，与头孢唑林、头孢噻吩的被动皮肤过敏反应交叉性也较弱。另外，库姆斯氏阳性反应较头孢噻吩明显减弱。

【贮藏】密封，在凉暗（避光并不超过20℃）干燥处保存。

【包装】中硼硅玻璃管制注射剂瓶、注射用无菌粉末用覆乙烯四氟乙烯共聚物膜氯化丁基橡胶塞、抗生素瓶用铝塑组合盖包装；10瓶/盒。

【有效期】24个月。

【执行标准】YBH03392023

【批准文号】（1）0.5g规格：国药准字H20233321 （2）1.0g规格：国药准字H20233322

【药品上市许可持有人】

企业名称：海口市制药厂有限公司

注册地址：海南省海口市秀英区南海大道192号

【生产企业】

企业名称：海口市制药厂有限公司

生产地址：海南省海口市秀英区南海大道192号

邮政编码：570311

电话号码：0898-68650115

销售电话：0898-36651533

网 址：www.haiyao.com.cn