核准日期：2006 年 10 月 18 日
修改日期：2007 年 02 月 20 日
2007 年 04 月 27 日
2010 年 10 月 01 日
2012 年 10 月 01 日
2015 年 12 月 01 日

注射用头孢哌酮钠说明书

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：注射用头孢哌酮钠

英文名称：Cefoperazone Sodium for Injection

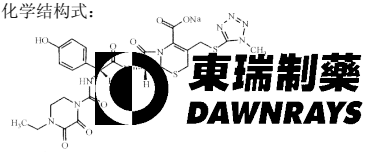
汉语拼音：Zhusheyong Toubaopaitong Na

【成份】

本品主要成份为头孢哌酮钠，无辅料。

化学名称：（6R，7R）-3-［[（1-甲基-1H-四唑-5-基）硫］甲基］-7-［（R）-2-（4-乙基-2，3-二氧代-1-哌嗪碳酰氨基）-2-对羟基苯基-乙酰氨基］-8-氧代-5-硫杂-1-氮杂双环［4.2.0］辛-2-烯-2-甲酸钠盐

化学结构式：



分子式：$C_{25}H_{26}N_9NaO_8S_2$

分子量：667.66

【性状】本品为白色至微黄色结晶性粉末；无臭；结晶性粉末有引湿性。

【适应症】

本品可用于治疗由敏感菌所引起的下列感染：下呼吸道感染（如肺炎）；泌尿道感染；胆道感染（胆囊炎、胆管炎）；腹膜炎和其它腹腔内感染；败血症；皮肤和软组织感染；盆腔感染等。

与其它抗生素的联合使用：本品抗菌谱广，单独使用已足以治疗绝大多数感染，病情需要时也可和其它抗生素联合使用。如与氨基糖苷类抗生素一起使用时，治疗过程中应密切监测病人肾功能状况。

【规格】以 $C_{25}H_{27}N_9O_8S_2$ 计（1）0.5g（2）1.0g（3）1.5g（4）2.0g（5）3.0g

【用法用量】

可供肌内注射、静脉注射或静脉滴注。

成人常用量：一般感染，每次 1~2g，每 12 小时一次。严重感染，剂量也可增加到每次 2~3g，每 8 小时一次。成人一日剂量一般不超过 9g，但在免疫缺陷患者有严重感染时，剂量可加大至每日 12g。单纯性淋球菌尿道炎的推荐剂量为单次肌内注射 0.5g。由于头孢哌酮钠的主要排泄途径并非经肾脏，因而通常的每日 2~4g 剂量下，肾衰竭病人亦无需调整剂量，如病人的肾小球滤过率低于 18 毫升/分钟，或血清肌酐高于 3.5mg/100ml，每日最高剂量为 4g。头孢哌酮和氨基糖苷类抗生素不宜混合使用，如需这两种药物联合应用，则必须分开静脉输注，并建议先给予头孢哌酮钠。

本品已被有效的用于婴儿感染的治疗，但对新生儿及早产儿尚未见广泛研究资料，以下剂量仅供参考。婴儿及儿童的每日剂量按体重 50~200mg/kg，分两次注射（每隔 12 小时），如需要时亦可分成多次注射，每日最大剂量不超过 6g。出生不足 8 日的新生儿须每 12 小时注射一次。

静脉用药：采用静脉滴注时，将 1~2g 头孢哌酮钠溶于 5%葡萄糖注射液，0.9%氯化钠注射液及其它适当稀释液中，最后药物浓度 5~25mg/ml；采用直接静脉缓慢注射时，每 1g 药物以葡萄糖或氯化钠稀释液 40ml 溶解至最终浓度 25mg/ml，且注射时间不得少于 3~5 分钟，用稀释液静脉注射时绝对不能加入利多卡因。

肌内注射：可用灭菌注射用水来配制肌内注射溶液。每 1g 药物加入灭菌注射用水 2.8ml，浓度在 250mg/ml 以上时，应同时加 2%盐酸利多卡因注射液进行配制，注射时采用深部肌内注射，注射于臀大肌或前股肌内。

【不良反应】

本品临床试验中和上市后报告的不良反应和不良事件有：

过敏反应：与所有头孢菌素一样头孢哌酮钠曾引起过敏反应，主要症状是斑丘疹、荨麻疹、嗜酸性粒细胞数增多、药物热。这类过敏反应易发生于有过敏病史，特别是对青霉素过敏的病人。

血液：曾有报导本品可引起中性粒细胞数减少。与其它 β-内酰胺类抗生素一样，长期使用头孢哌酮钠可能会导致可逆性中性粒细胞减少症，在使用头孢菌素类抗生素治疗中，一些病人出现直接库姆斯（coombs）试验阳性反应。与文献报道的关于其它头孢菌素的情况一样，亦曾有报导头孢哌酮钠会降低血红蛋白及血细胞压积。曾发现有短暂性的嗜酸性粒细胞增多现象。血小板减少、凝血酶原时间延长、凝血酶原活力降低等偶见。

肝脏：曾发现血清丙氨酸转氨酶（ALT）、血清天门冬氨酸转氨酶（AST）和碱性磷酸酶数值一过性升高。

胃肠道：偶有稀便和腹泻，多为轻度到重度。经适当治疗或停药后，上述症状可自行消失。

局部反应：对于肌内注射，病人耐受良好，偶有注射部位短暂疼痛；与其它头孢菌素一样，用静脉内插管输注时，少数病人会有输注部位静脉炎。

【禁忌】禁用于对本品和其它头孢菌素类抗生素过敏的患者。

【注意事项】

警惕：使用头孢哌酮钠前，应详细询问病人是否有对头孢菌素类，青霉素类或其它药物的过敏史。如病人对青霉素过敏，应谨慎使用本品。对任何曾发生过某种过敏反应，尤其是对药物过敏的病人，使用本品应特别小心。

一旦发生过敏反应，应停药并给予适当治疗，发生严重过敏性休克的患者应立即给予肾上腺素，必要时吸氧、静脉给予激素，保持气道通畅，包括气管插管等治疗措施。

一般注意事项：

1.在室温（15~25℃）保存的用各种注射用稀释液配制成的不同浓度的头孢哌酮钠溶液应在 24 小时之内使用（超过此保存时间而未使用，应予弃去，不得再用）。

2.头孢哌酮钠大部分随胆汁排泄，当患者有肝脏疾患及/或胆道梗阻时，本品的血清半衰期常会延长，而由尿中排出的药量会增加。甚至在严重肝功能障碍的情况下，胆汁中仍可达到治疗浓度，而半衰期仅增加了 2~4 倍。在严重胆道梗阻、严重肝脏疾病，或同时存在肾功能障碍时，剂量可能需要调整。

3.如病人同时存在肝功能障碍和肾脏损害时，应监测头孢哌酮钠的血清浓度，并根据需要而调整剂量。对这种病人，如不能监测血清浓度，则剂量不应超过每日 2g。

4.在病人血液透析阶段头孢哌酮钠血清半衰期略微缩短，在血液透析完毕后，给药的时间需予以调整。

5.与其它抗生素一样，曾有少数病人使用头孢哌酮钠后引致维生素 K 缺乏。此种现象可能是由于合成维生素 K 的肠内细菌受到抑制所致，营养不良或吸收不良的病人（如囊性纤维变性）以及长期由静脉输注营养的病人容易出现这种情况，对这类病人应密切监测其凝血酶原时间，必要时应加用维生素 K。

6.使用头孢哌酮期间及停药后 5 天内饮酒，会引起面部潮红、出汗、头痛、心动过速等反应，其它一些头孢菌素亦曾有类似反应。因而病人在使用头孢哌酮钠时，如同时饮用含酒精饮料应格外注意。当病人需要鼻饲或

胃肠外给予高营养制剂时，应避免在流质或输注营养液中含酒精成分。

7.与其它抗生素一样，长期使用头孢哌酮钠可能会导致不敏感微生物过度生长，在治疗期间，应仔细观察病人状况。

8.药物实验室检查：本尼迪特氏或费林氏试验查尿中葡萄糖，本品可能呈假阳性反应。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

1.妊娠期用药：曾用小鼠、大鼠和猴试验此药对于生殖的影响，当剂量高达人用量的 10 倍，未发现生育力受损，亦未发现有畸胎出现。但目前尚没有在孕妇中进行充分的严格对照研究的资料。由于动物试验结果不能完全预测人类的反应，因此，只有在医生认为必须的情况下孕妇才可使用本品。

2.哺乳期用药：尽管只有少量头孢哌酮钠排入母乳中，但哺乳期妇女使用仍应特别小心。

【儿童用药】

头孢哌酮钠已被有效地用于婴儿感染的治疗中，对于早产儿及新生儿尚未作广泛研究，因此本品用于治疗早产儿及新生儿感染前，医生需认真考虑，权衡利弊。对于新生儿黄疸，头孢哌酮钠不会将胆红素从与血浆蛋白的结合中置换下来。

【老年用药】尚未明确。

【药物相互作用】

（1）头孢哌酮与氨基糖苷类抗生素（庆大霉素和妥布霉素）联合应用时对肠杆菌科细菌和铜绿假单胞菌的某些敏感菌株有协同作用。

（2）头孢哌酮与能产生低凝血酶原血症、血小板减少症或胃肠道溃疡出血的药物同时应用时，要考虑到这些药对凝血功能的影响和出血危险性增加。抗凝药肝素、香豆素或茚满二酮衍生物及溶栓剂与具有甲硫四氮唑侧链的头孢哌酮合用时可干扰维生素 K 代谢，导致低凝血酶原血症。非甾体抗炎镇痛药，特别是阿司匹林、二氟尼柳（diflunisal）或其他水杨酸制剂、血小板聚集抑制剂，磺吡酮等与头孢哌酮合用时可由于对血小板的累加抑制作用而增加出血的危险性。

（3）应用含有甲硫四氮唑侧链的头孢哌酮期间，饮酒或静脉注射含乙醇药物，将抑制乙醛去氢酶的活性，使血中乙醛积聚，出现双硫仑样反应。病人面部潮红，诉头痛、眩晕、腹痛、胃痛、恶心、呕吐、心跳、气急、心率加速、血压降低，以及嗜睡、幻觉等。症状出现于饮酒后 15~30 分钟或静脉输入含有乙醇的溶液时，数小时后自行消失。在应用头孢哌酮期间直至停药后 5 天饮酒皆可出现此反应。因此在用药期间和停药后 5 天内，病人不得饮酒、口服或静脉输入含有乙醇的药物。

（4）β-内酰胺类（青霉素类和头孢菌素）抗生素与氨基糖苷类抗生素直接混合后，两者的抗菌活性将相互影响而减弱；因此两类药物联合应用时，不能在同一容器内给予。

（5）头孢哌酮与下列药物注射剂有配伍禁忌：阿米卡星、庆大霉素、卡那霉素 B、多西环素、甲氯芬酯、阿马林（缓脉灵）、苯海拉明和门冬氨酸钾镁与本品混合后立即有沉淀。盐酸羟嗪（安太乐）、普鲁卡因胺、氨茶碱、丙氯拉嗪、细胞色素 C、喷他佐辛（镇痛新）、抑肽酶等与本品混合后，6 小时内外观发生变化。头孢哌酮的水溶液与胶体制剂及含胺、胺碱制剂配合产生沉淀；与碱性制剂配合因发生水解而效价降低。

【药物过量】

有关人体发生头孢哌酮急性中毒的资料有限。预计本品药物过量所出现的临床表现主要是那些已经报道的不良反应的加重。应确定这样一个事实，脑脊液中高浓度 β-内酰胺类抗生素可引起中枢神经系统副作用，如抽搐等。由于头孢哌酮可通过血液透析从血循环中被置换出来。因此，如肾功能损害的患者发生药物过量，通过血液透析治疗可增加本品从体内的排出。

【药理毒理】

头孢哌酮钠通过抑制细菌细胞壁的合成产生杀菌作用，体外试验中，对许多临床常见的细菌有杀菌作用且能抗拒多种 β-内酰胺酶的降解，对本品敏感的细菌包括：

革兰阳性菌：金黄色葡萄球菌（包括产生和不产生青霉素酶的菌株），表皮葡萄球菌；肺炎链球菌（前称肺炎双球菌）、化脓性链球菌（A 组 β-溶血性链球菌），无乳链球菌（B 组 β-溶血性链球菌），粪链球菌的多种菌株，其它 β-溶血性链球菌株。

革兰阴性菌：大肠埃希菌、克雷伯氏菌属、肠杆菌属、枸橼酸杆菌属、流血嗜血杆菌（包括产生和不产生 β-内酰胺酶的菌株）、奇异变形杆菌、普通变形杆菌、摩氏摩根氏菌（也称摩根氏变形杆菌）、雷氏普罗菲登斯菌（也称雷特格氏变形杆菌）、普罗菲登斯菌属、沙雷氏菌属（包括粘质沙雷氏菌）、沙门氏菌属和志贺氏菌属、铜绿假单胞菌和某些其它假单胞菌属、某些醋酸钙不动杆菌菌株、淋病奈瑟氏菌（包括产生和不产生 β-内酰胺酶的菌株），脑膜炎球菌、百日咳杆菌、小肠结肠炎耶尔森氏菌。

厌氧菌：革兰阳性和阴性球菌（包括消化球菌、消化链球菌和韦荣氏球菌属），革兰阳性杆菌（包括梭状芽孢杆菌属、优杆菌属和乳酸杆菌属），革兰阴性杆菌（包括梭杆菌属、脆弱类杆菌和其它类杆菌属的许多菌株）。

【药代动力学】

单剂量注射后，头孢哌酮在血清、胆汁和尿中可达到高浓度，丙磺舒对头孢哌酮钠的血清浓度并无影响。头孢哌酮的平均血清半衰期约为 2 小时，不受给药途径的影响。经注射后，头孢哌酮钠可分布在绝大多数体液及组织中，诸如：腹水、尿、胆汁及胆囊壁、痰及肺、腭扁桃体及鼻粘膜、心耳、肾、输尿管、前列腺、睾丸、子宫及输卵管、骨、脐带血和羊水中，均能达到治疗浓度。经胆汁和尿排泄，注射后 1~3 小时内，胆汁中浓度达到峰值，比同期血清浓度高出一百倍。据报导，对无胆道梗阻的病人静脉注射 2 克后，胆汁中的浓度从 30 分钟的 66 微克/毫升上升至 3 小时的 6000 微克/毫升。对于肾功能正常的，以各种不同的途径和不同剂量给药，12 小时内尿中回收的药量平均为 20~30%，15 分钟内静脉输注 2 克后，尿中的浓度可高达 2200 微克/毫升，肌内注射 2 克后，尿中药物峰浓度约为 1000 微克/毫升。健康志愿者多次反复给药后，未出现体内积蓄现象。肾功能不全者的血清峰浓度、曲线下面积、血清半衰期与健康人相似。对于肝功能不全的患者，其血清半衰期会延长，而经尿排泄的量会增加。在同时合并有肾及肝功能不全病人，则可能在血清中积蓄。

【贮藏】密闭，凉暗处（避光并不超过 20℃）保存。

【包装】西林瓶装。1 瓶/盒(1.5g、2.0g、3.0g)；10 瓶/盒。

【有效期】24 个月

【执行标准】《中国药典》2015 年版二部

【批准文号】

国药准字 H20003249（0.5g）
国药准字 H10983022（1.0g）
国药准字 H20043027（1.5g）
国药准字 H20013194（2.0g）
国药准字 H20043028（3.0g）

【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天灵路 22 号
邮政编码：215128
电　　话：0512-65626868
传　　真：0512-65628688
网　　址：www.dawnrays.com