

核准日期：2008年09月12日
修改日期：2010年09月21日
修改日期：2011年07月13日
修改日期：2015年12月01日



注射用美洛西林钠说明书

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：注射用美洛西林钠

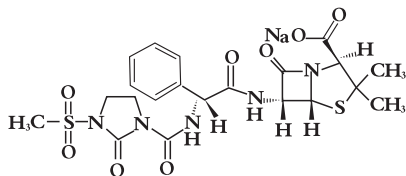
英文名称：Mezlocillin Sodium for Injection

汉语拼音：Zhusheyong Meiluoxilina

【成份】本品主要成份为美洛西林钠，无辅料。

化学名称：(2S, 5R, 6R)-3, 3-二甲基-6-[(2R)-[3-(甲磺酰基)-2-氧代-1-咪唑啉甲酰氨基]-2-苯乙酰氨基]-7-氧代-4-硫杂-1-氮杂双环[3.2.0]庚烷-2-甲酸钠盐。

化学结构式：



分子式： $C_{21}H_{24}NaN_5O_8S_2$

分子量：561.56

【性状】本品为白色或类白色的粉末或结晶或疏松块状物。

【适应症】用于大肠埃希菌、肠杆菌属、变形杆菌属等革兰阴性杆菌中敏感菌株所致的呼吸系统、泌尿系统、消化系统、妇科和生殖器官等感染，如败血症、化脓性脑膜炎、腹膜炎、骨髓炎、皮肤及软组织感染及眼、耳、鼻、喉科感染。

【规格】按 $C_{21}H_{24}N_5O_8S_2$ 计 (1)0.5g (2)1.0g (3)2.0g

【用法用量】肌内注射、静脉注射或静脉滴注。肌内注射临用前加灭菌注射用水溶解，静脉注射通常加入5%葡萄糖氯化钠注射液或5%~10%葡萄糖注射液溶解后使用。成人一日2~6g，严重感染者可增至8~12g，最大可增至15g。

儿童，按体重一日0.1~0.2g/kg，严重感染者可增至0.3g/kg；肌内注射一日2~4次，静脉滴注按需要每6~8小时一次，其剂量根据病情而定，严重者每4~6小时静脉注射一次。

【不良反应】不良反应主要有：食欲缺乏、恶心、呕吐、腹泻、肌注局部疼痛和皮疹，且多在给药过程中发生，大多程度较轻，不影响继续用药，重者停药后上述症状迅速减轻或消失。少数病例可出现血清氨基转移酶、碱性磷酸酶升高及嗜酸性粒细胞一过性增多。中性粒细胞减少、低钾血症等极为罕见。未见肾功能改变以及血液电解质紊乱等严重反应。

【禁忌】对青霉素类抗生素过敏者禁用。

【注意事项】

1. 用药前须做青霉素皮肤试验，阳性者禁用。
2. 交叉过敏反应：对一种青霉素类抗生素过敏者可能对其他青霉素类抗生素也过敏。也可能对青霉素胺或头孢菌素类过敏。
3. 肾功能减退患者应适当降低用量。
4. 下列情况应慎用：有哮喘、湿疹、枯草热、荨麻疹等过敏性疾病史者。
5. 对诊断的干扰：(1)用药期间，以硫酸铜法进行尿糖测定时可出现假阳性，用葡萄糖酶法则不受影响；(2)大剂量注射给药可出现高钠血症；(3)可使血清丙氨酸氨基转移酶或天门冬氨酸氨基转移酶升高。
6. 应用大剂量时应定期检测血清钠。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

本品可透过胎盘进入胎儿血循环，并有少量随乳汁分泌，哺乳期妇女应用本品虽尚无发生严重问题的报告，但孕妇及哺乳期妇女应用仍须权衡利弊，因其应用后可使婴儿致敏和引起腹泻、皮疹、念球菌属感染等。

【儿童用药】尚不明确。

【老年用药】老年患者肾功能减退，须调整剂量。

【药物相互作用】

1. 氯霉素、红霉素、四环素类等抗生素和磺胺药等抑菌剂可干扰本品的杀菌活性，不宜与本品合用，尤其是在治疗脑膜炎或急需杀菌剂的严重感染时。
2. 丙磺舒、阿司匹林、吡罗美辛、保泰松、磺胺药可减少本品自肾脏排泄，因此与本品合用时使其血药浓度增高，排泄时间延长，毒性也可能增加。
3. 本品与重金属，特别是铜、锌和汞呈配伍禁忌，因后者可破坏其氧化噻唑环。由锌化合物制造的橡皮管或瓶塞也可影响其活力。也可为氧化剂、还原剂或羟基化合物灭活。
4. 本品静脉输液加入头孢噻吩、林可霉素、四环素、万古霉素、琥乙红霉素、两性霉素B、去甲肾上腺素、间羟胺、苯妥英钠、盐酸羟嗪、丙氯拉嗪、异丙嗪、维生素B族、维生素C等后将出现混浊。
5. 避免与酸碱性强度的药物配伍，pH4.5以下会有沉淀发生，pH4.0以下及pH8.0以上效价下降较快。
6. 本品可加强华法林的作用。
7. 与氨基糖苷类抗生素合用有协同作用，但混合后，两者的抗菌活性明显减弱，因此两药不能置同一容器内给药。

【药物过量】尚不明确。

【药理毒理】

本品为半合成青霉素类抗生素，对铜绿假单胞菌、大肠埃希菌、肺炎杆菌、变形杆菌属、肠杆菌属、枸橼酸杆菌、沙雷菌属、不动杆菌属以及对青霉素敏感的革兰阳性球菌均有抑菌作用，大剂量有杀菌作用。对大肠埃希菌、肠杆菌属、肺炎杆菌、枸橼酸杆菌、沙雷菌属以及不动杆菌属等的抗菌活性强于羧苄西林、氨苄西林；对吡罗美辛、金黄色葡萄球菌的抗菌活性与羧苄西林相似，而对粪链球菌的抗菌活性比羧苄西林、磺苄西林优越。对脆弱拟杆菌等大多数厌氧菌具有较好抗菌作用。

本品体外试验表明其对细菌所产生的β内酰胺酶不稳定。

本品与庆大霉素、卡那霉素等氨基糖苷类抗生素联合应用有显著协同作用。

【药代动力学】

成人静脉注射本品1g、2g后15分钟平均血药浓度分别为53.4μg/ml、152μg/ml，1小时后分别为12.8μg/ml、47.8μg/ml，6小时后已无法测得血药浓度，血消除半衰期($t_{1/2\beta}$)分别为39分钟、45分钟，6小时后给药量的42.5%、57.9%由尿中排泄。1小时内静脉滴注2g，滴注结束时血药浓度为86.5μg/ml，1小时后为28.3μg/ml，血消除半衰期($t_{1/2\beta}$)为40分钟。本品在胆汁中浓度极高，1小时内滴注2g，最高可达248~1070μg/ml，6小时后仍保持63.5~300μg/ml，胆汁排泄率为1.65%~7.0%。

本品到达脑脊液的渗透率为17%~25%，蛋白结合率为42%，尿排泄率为50%~55%，胆汁消除率变化较大，从0.05%~25%（与患者肝功能有关）。其生物半衰期约为1小时，肌注约为1.5小时，小于7天的新生儿约为4.3小时。

在新生儿静滴100mg/kg后，血药浓度的降低较缓慢，5小时后尚可检出。在小儿脑膜炎症例中，脑脊液内药物浓度最高可达23μg/ml。小儿脓胸，在静脉滴注100mg/kg后，胸水中最高浓度达到6.3μg/ml，而且持续时间很长。

妊娠妇女静脉滴注1~2g，1~2小时后27%~34%转移至脐带血中，羊水中药物浓度约为10μg/ml。

【贮藏】密封，在凉暗（避光并不超过20℃）干燥处保存。

【包装】钠钙玻璃模制注射剂瓶、注射用无菌粉末用卤化丁基橡胶塞包装。包装规格：

(1) 每盒10瓶；(2) 每盒12瓶，配预灌封注射器组合件（带注射针）。

【有效期】24个月

【执行标准】《中国药典》2015年版二部

【批准文号】(1) 0.5g国药准字H20084065

(2) 1.0g国药准字H20084066

(3) 2.0g国药准字H20084067

【生产企业】

企业名称：四川制药制剂有限公司

生产地址：四川省成都市高新西区百叶路18号

邮政编码：611731

电话号码：028-62808555

传真号码：028-62808550