

核准日期：2006 年 10 月 26 日

修改日期：2010 年 12 月 29 日 2015 年 6 月 8 日 2015 年 11 月 30 日

注册商标

## 注射用头孢呋辛钠说明书

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：注射用头孢呋辛钠

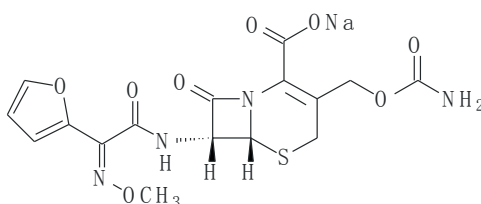
英文名称：Cefuroxime Sodium for Injection

汉语拼音：Zhusheyong Toubaofoxinna

【成份】本品的主要成份为头孢呋辛钠。

化学名称：(6R, 7R)-7-[2-(呋喃-2-基)-2-(甲氧亚氨基)乙酰氨基]-3-氨基甲酰氧甲基-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： $C_{16}H_{15}N_4NaO_8S$

分子量：446.37

【性状】本品为白色至微黄色粉末或结晶性粉末。

【适应症】本品可用于对头孢呋辛敏感的细菌所致的下列感染：

1. 呼吸道及耳鼻喉感染：由肺炎链球菌、流感嗜血杆菌(含氨苄青霉素耐药菌)、克雷伯氏杆菌属、金黄色葡萄球菌(青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌)、化脓性链球菌及大肠杆菌所引起的呼吸道感染，如中耳炎、鼻窦炎、扁桃体炎、咽炎和急、慢性支气管炎、支气管扩张合并感染、细菌性肺炎、肺脓肿和术后肺部感染。

2. 泌尿道感染：由大肠杆菌及克雷伯氏杆菌属细菌所致的尿道感染，如肾盂肾炎、膀胱炎和无症状性菌尿症。

3. 皮肤及软组织感染：由金黄色葡萄球菌(青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌)、化脓性链球菌、大肠杆菌、克雷伯氏杆菌属及肠道杆菌属细菌所致的皮肤及软组织感染，如蜂窝组织炎、丹毒、腹膜炎及创伤感染。

4. 败血症：由金黄色葡萄球菌(青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌)、肺炎链球菌、大肠杆菌、流感嗜血杆菌(含氨苄青霉素耐药菌)及克雷伯氏杆菌属细菌所引起的败血症。

5. 脑膜炎：由肺炎链球菌、流感嗜血杆菌(含氨苄青霉素耐药菌)、脑膜炎奈瑟氏菌及金黄色葡萄球菌(青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌)所引起的脑膜炎。

6. 淋病：由淋病奈瑟氏菌(青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌)所引起的单纯性(无合并症)及有合并症的淋病，尤其适用于不宜用青霉素治疗者。

7. 骨及关节感染：由金黄色葡萄球菌(青霉素酶产酶菌及非青霉素酶产酶菌)所引起的骨及关节感染。

本品可用于术前或术中防止敏感致病菌的生长，减少术中及术后因污染引起的感染。如腹部骨盆及矫形外科手术、心脏、肺部、食道及血管手术、全关节置换手术中的预防感染。

【规格】按  $C_{16}H_{16}N_4O_8S$  计 0.75g

【用法用量】可深部肌内注射，也可静脉注射或静脉滴注。肌内注射前，必须回抽无血才可注射。

肌内注射给药时，每 0.25g 用 1.0ml 灭菌注射用水溶解，缓慢摇匀得混悬液后，方可

深部肌内注射。

静脉注射：0.25g 至少用 2.0ml 灭菌注射用水溶解，摇匀后再缓慢静脉注射，也可加入静脉输注管内滴注。

本品成人常用量为一次 0.75g~1.5g，每 8 小时给药一次，疗程 5~10 天。对于危及生命的感染或罕见敏感菌引起的感染，应每 6 小时使用 1.5g 剂量。对于细菌性脑膜炎，使用剂量应每 8 小时不超过 3.0g。对于单纯性淋病应肌注单剂量 1.5g，可分注于二侧臀部，并同时口服 1g 丙磺舒。

预防手术感染：术前 0.5~1.5 小时静脉注射本品 1.5g，若手术时间过长，则每隔 8 小时静脉注射或肌内注射 0.75g 剂量。若为开胸手术，应随着麻醉剂的引入，静注 1.5g；以后每隔 12 小时给药一次，总剂量为 6g。

3 个月以上的患儿，每日每公斤体重 50~100mg，分 3~4 次给药。重症感染，每日每公斤体重，用量不低于 0.1g，但不能超过成人使用的最高剂量。骨和关节感染，每日每公斤体重 0.15g(不超过成人使用的最高剂量)，分 3 次给药。脑膜炎患者每日每公斤体重 0.2~0.24g，分 3~4 次给药。小儿每日最高剂量不超过 6g。

肾功能不全者，应根据肾功能损害的程度来调整用法与用量，推荐调整方法见下表。

肾功能不全的患儿，亦应参照下表进行调整。

| 肌酐清除率(ml/min) | 剂量        | 间隔      |
|---------------|-----------|---------|
| >20           | 0.75~1.5g | 每 8 小时  |
| 10~20         | 0.75g     | 每 12 小时 |
| <10           | 0.75g     | 每 24 小时 |

**【不良反应】**本品耐受情况良好，常见不良反应如下：

1. 局部反应：如血栓性静脉炎等。
2. 胃肠道反应：如腹泻、恶心、伪膜性结肠炎等。
3. 过敏反应：常见为皮疹、瘙痒、荨麻疹等。偶见过敏症、药物热、多形性红斑、间质性肾炎、中毒性表皮剥脱性皮炎、斯约综合症。
4. 血液：可见血红蛋白和红细胞压积减少、一过性嗜酸粒细胞增多、一过性的嗜中性粒细胞减少及白细胞减少等，偶见血小板减少。
5. 肝功能：可见 ALT、AST、碱性磷酸酶、乳酸脱氢酶及血清胆红素一过性升高。
6. 其他：尚见呕吐、腹痛、结膜炎、阴道炎(包括阴道念珠球菌病)、肝功能异常(包括胆汁郁积)、再生障碍性贫血、溶血性贫血、出血、引发癫痫、凝血酶原时间延长、各类血细胞减少、粒细胞缺乏症等。

**【禁忌】对头孢菌素类药物过敏者禁用本品。**

**【注意事项】**

1. 本品与青霉素类有交叉过敏反应。对青霉素类药过敏者，慎用本品。有青霉素过敏性休克者，不宜选用本品。
  2. 使用本品时，应注意监测肾功能，特别是对接受高剂量的重症患者。
  3. 肾功能不全者应减少每日剂量。合并应用强效利尿药或氨基糖苷类抗生素治疗的患者应特别注意，因为曾有合并治疗引起肾功能损坏的报道。对于患者，最好进行肾功能监测。
  4. 本品能引起伪膜性肠炎，应警惕。伪膜性肠炎诊断确立后，应给予适宜的治疗。轻度者停药即可，中、重度者应给予液体、电解质、蛋白质补充，并需选用对梭状芽孢杆菌有效的抗生素类药物进行治疗。
  5. 有报道少数患儿使用本品时出现轻、中度听力受损。
  6. 相容性和稳定性。
- 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。

肌内注射：用灭菌注射用水配制时，本品混悬液在室温 24 小时，冰箱 5℃ 保存 48 小时可保持活性。超过期限的任何未用的溶液都应丢弃。

静脉注射：用灭菌注射用水配制时，0.25g，0.75g，1.5g 配制后的溶液在室温 24 小时，冰箱 5℃ 保存 48 小时可保持活性。过了这个期限，任何未用的溶液都应丢弃。

本品在室温下与以下一些溶液在室温存放 24 小时和或冰箱存放 7 天时活性降低不超过 10%：肝素(10~50 μg/ml)，氯化钾 (10~40mEq/L)，碳酸氢钠，0.9%氯化钠。装在抗生素瓶中的 0.25g、0.75g 和 1.5g 三种规格的注射用头孢呋辛钠，用 20ml，50ml 或 100ml 5%葡萄糖注射液，0.9%氯化钠注射液，0.45%氯化钠注射液稀释。

7. 对诊断的干扰：本品可干扰直接参与 Coombs 实验结果，出现假阳性结果，此现象会干扰血液的交叉配型。对本尼迪克特试验或费林氏试验或 Clintest tablets 试纸检测尿糖时会出现假阳性反应，但用酶的方法监测时则不会出现假阳性。在查血糖时如用铁氰酸方法可出现假阳性结果。

【孕妇及哺乳期妇女用药】孕妇应权衡利弊。本品能通过乳汁排泄，哺乳期妇女慎用。

【儿童用药】有报道新生儿对头孢菌素有蓄积作用，三个月以下儿童的安全有效性尚未确定，因而不推荐使用。

【老年用药】65 岁以上的患者给药量可减少至正常量的 2/3~1/2，每日剂量不超过 3g。

#### 【药物相互作用】

1. 有报道氨基糖苷类抗生素与头孢菌素联合用药可导致肾毒性。

2. 临床应用头孢菌素患者用斑氏或费氏或 Clintest Tablets 试纸检测尿糖时会出现假阳性反应，但用酶的方法试验则不会出现假阳性。在测血糖时如用铁氰酸方法可出现假阴性结果，头孢呋辛钠不会干扰用碱性苦味酸方法测定尿和血肌酐值。

3. 头孢呋辛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、乳糖酸红霉素、林可霉素、磺胺异噁唑、氨茶碱、可溶性巴比妥类、氯化钙、葡庚糖酸钙、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。

偶亦可能与下列药品发生配伍禁忌：青霉素、甲氧西林、琥珀酸氢化可的松钠、苯妥英钠、丙氯拉嗪、维生素 B 族和维生素 C、水解蛋白。

4. 呋塞米、依他尼酸、布美他尼等强利尿药，卡氮芥、链佐星等抗肿瘤药以及氨基糖苷类抗生素与头孢呋辛合用有增加肾毒性的可能。

5. 克拉维酸可增强头孢呋辛对某些因产生 β-内酰胺酶而对之耐药的革兰阴性杆菌的抗菌活性。

【药物过量】过量使用会刺激大脑发生惊厥，血液透析法或腹膜透析法可降低本品的血清浓度。

#### 【药理毒理】

药理作用

本品为广谱的第二代头孢菌素，其作用机理是通过结合细菌蛋白，从而抑制细菌细胞壁的合成。头孢呋辛对于病原菌具有较高的抗菌活性，并对许多 β-内酰胺酶稳定，尤其是对肠杆菌科中常见的质粒介导酶稳定。

动物体外试验和临床感染治疗中证实，头孢呋辛对下列大部分细菌有抗菌活性。

需氧革兰阳性菌：

金黄色葡萄球菌(包括 β-内酰胺酶产生菌)、肺炎链球菌、化脓性链球菌。

需氧革兰阴性菌：

大肠埃希菌、流感杆菌(包括产 β-内酰胺酶菌)、副流感嗜血杆菌、肺炎克雷伯菌、

卡他莫拉菌(包括产 $\beta$ -内酰胺酶菌)、淋病奈瑟菌(包括产 $\beta$ -内酰胺酶菌)。

体外试验表明, 粪肠球菌、耐甲氧西林金黄色葡萄球菌、艰难梭菌和脆弱拟杆菌的大部分菌株对头孢呋辛耐药。

#### 毒理研究

遗传毒性: 虽然未进行动物的终身研究以评价本品潜在的致癌性, 但是微核试验和细菌试验中, 未发现本品有致突变作用。

生殖毒性: 大鼠给予本品剂量达 1000mg/kg/天, 对动物生育力无明显影响。小鼠和大鼠给予本品剂量达 3200mg/kg/天, 未见对胎儿发育的损害。但是动物与人的相关性尚无临床研究的支持。

#### 【药代动力学】

据 Physicians' Desk Reference 介绍, 对健康受试者肌注 0.75g 的头孢呋辛, 平均血药峰浓度为 27  $\mu$ g/ml, 达峰时间为 45 分钟(范围从 15~60 分钟)。静注给予 0.75g 和 1.5g 后, 15 分钟时的血药浓度分别达 50  $\mu$ g/ml 和 100  $\mu$ g/ml 左右, 血药浓度高于有效血药浓度(2  $\mu$ g/ml)的时间可分别维持 5.3 小时和 8 小时或更久。健康受试者每 8 小时静脉注射给予头孢呋辛 1.5g, 无蓄积作用。经肌内注射或静脉注射给药的半衰期约为 80 分钟。

约 89% 的药物在给药后 8 小时内经肾排泄, 故导致尿药浓度较高。

单剂量 0.75g 肌注头孢呋辛后 8 小时, 尿药浓度平均可达 1300  $\mu$ g/ml。单剂量 0.75g 和 1.5g 静注头孢呋辛后 8 小时, 尿药浓度平均可达 1150  $\mu$ g/ml 和 2500  $\mu$ g/ml。

若同时口服丙磺舒, 则可延长头孢呋辛的肾小管排泄时间, 降低肾清除率约为 40%, 提高血药浓度约 30%, 延长血浆半衰期约 30%。头孢呋辛可在胸膜液、关节液、胆汁、痰液、骨和眼房水中达到治疗浓度。

研究表明成人和儿童脑膜炎患者的脑脊液中, 头孢呋辛可达到治疗浓度。多次用药的脑膜炎患者的脑脊液中可测到头孢呋辛。

头孢呋辛的血清蛋白结合率约 50%。

【贮藏】遮光, 密封, 在阴凉处(不超过 20 $^{\circ}$ C)保存。

【包装】抗生素瓶装, 每小盒 1 瓶; 抗生素瓶装, 每盒 10 瓶。

【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 H20064974

#### 【生产企业】

企业名称: 注册商标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>