

核准日期：2007 年 04 月 23 日
修改日期：2009 年 07 月 01 日
2010 年 08 月 25 日
2010 年 10 月 01 日
2012 年 04 月 24 日
2015 年 12 月 01 日
2020 年 12 月 01 日
2024 年 03 月 12 日
2024 年 07 月 25 日
2024 年 11 月 20 日

注射用美洛西林钠说明书

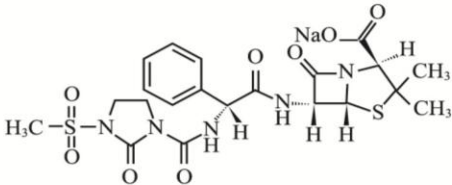
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

【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 Meiluoxilinna

【成份】

本品主要成份为美洛西林钠。
化学名称：(2S, 5R, 6R)-3,3-二甲基-6-[(2R)-[3-(甲磺酰氨基)-2-氧代-1-咪唑烷甲酰氨基]-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：C₂₁H₂₆NaN₃O₈S₂ 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、咽科感染。

【规格】1.0g (按 C₂₁H₂₆N₃O₈S₂ 计)

【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】

1. 胃肠道反应：偶有腹泻、恶心、呕吐等。腹泻通常在治疗期间或不再继续用药时即可消失。出现严重和持续腹泻时，应考虑出现潜在致命的抗生素诱发伪膜小肠结肠炎的可能性，这时必须立即停用本品并采取相应的治疗（如口服万古霉素 250mg，每日 4 次），禁用减少蠕动药物。罕见消化不良、食欲不振、腹胀。此外还可能出现腹痛、口干、黑毛舌等。

2. 过敏反应：偶有过敏反应，通常为皮肤反应（例如皮疹、瘙痒）。个别病例出现严重皮肤反应，如中毒性表皮坏死综合征、史蒂文斯-约翰逊综合征。此外，还可能出现多形性红斑、剥脱性皮炎。出现荨麻疹时（青霉素过敏即发荨麻疹反应）必须停用本品。也不能继续使用其它青霉素类抗菌药物治疗。

严重其他罕见过敏反应有嗜酸性粒细胞增多、药物热、急性间质性肾炎及脉管炎。此外还可能出现喉水肿、血管神经性水肿、血清病样反应、溶血性贫血。个别病例出现致命的过敏性休克。常用的急救措施包括立即静脉注射肾上腺素、静脉注射扩容代用品及静注高剂量皮质类固醇（成人用量相当于 250 ~ 1000mg 氢化泼尼松）等。

3. 血液系统反应：用高剂量本品时罕见血小板功能紊乱，如出血时间延长、紫癜或黏膜出血。通常仅见于严重肾功能损害患者中。若临床上发生出血，且出血的其他原因不明时，必须停用本品。个别患者出现白细胞减少、粒细胞缺乏症、贫血、血小板减少症。长期用药应监测血象。

4. 神经系统反应：高剂量静注青霉素类药物，因脑脊液中药物浓度过高，可能出现激惹、肌肉痉挛及惊厥等。肾功能损伤患者若不调整剂量，由于大脑疾病增加了药物进入脑脊液，可增加惊厥发生率。此外还可能出现味觉刺激、头晕、头痛、感觉减退、震颤、局部麻木、嗜睡、眩晕等。

5. 全身性和给药部位反应：偶见注射部位疼痛，罕见血栓性静脉炎。还可能出现胸部不适、寒战、发热、肿胀、乏力、注射部位皮疹、瘙痒等。

6. 各类检查异常：转氨酶（AST，ALT）一过性升高或碱性磷酸酶升高、低钾血症、胆红素升高、肌酐升高、非蛋白氮升高及 Coombs 试验阳性、嗜酸性粒细胞一过性增多、中性粒细胞减少等。

7. 其他反应：关节疼痛、肌痛、呼吸困难、心悸、潮红、血压升高、血压降低、眼部周围水肿、视觉损害、耳鸣、眩晕、抽动、烦躁不安、肝功能异常、尿尿等。

8. 长期或重复使用可导致耐药细菌或条件性致病真菌的共生或二次感染。

9. 使用青霉素治疗梅毒或其他螺旋体感染的患者可能会发生赫氏反应（Jarisch-Herxheimer reaction）。

10. 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. 接受美洛西林钠治疗的患者有发生严重过敏反应的风险，包括过敏性休克。过敏反应更容易发生在具有青霉素类药物过敏史和 / 或对多种过敏原有过敏史的患者中，有明显过敏和 / 或哮喘病史的患者（有哮喘、湿疹、枯草热、荨麻疹等过敏性疾病患者）应慎用。一旦出现呼吸困难、血压下降、意识丧失等症状，应立即停药，并采取适当的紧急救治措施包括给予肾上腺素。

4. 本品不宜与其他药品配伍使用，与其他药品序贯使用时应更换输液器。注射用美洛西林钠与酸碱性较强的药物配伍，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。注射用美洛西林钠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、盐酸羟胺、丙氯拉唑、异丙嗪、维生素 B 族、维生素 C 等后会出现混浊。

5. 肾功能减退患者应适当降低用量。

6. 大剂量静脉给予美洛西林钠或有严重肾功能不全的患者，可能会引起神经毒性反应，包括反射亢进、肌阵挛性抽搐、惊厥和昏迷。

7. 与出血时间延长、紫癜和黏膜出血相关的小血小板功能障碍主要发生在肾功能受损的患者中。若临床上发生出血，且出血的其他原因不明时，必须停用本品。

8. 严重电解质紊乱的患者使用本品时，应注意本品含钠的影响。大剂量美洛西林钠可出现高钠血症，有时低钾血症。使用保钾利尿药可能会有所帮助。长期大剂量治疗的患者，应监测电解质平衡、造血功能和肾功能。

9. 包括美洛西林在内的几乎所有的抗菌药物在应用中都曾有过艰难梭菌相关性腹泻（CDAD，Clostridium difficile associated diarrhea）的报道，其严重程度从轻度腹泻到致死性的结肠炎不等。抗菌药物治疗会改变患者结肠部位的正常菌群，导致艰难梭菌过度生长。

艰难梭菌产生的毒素 A 和 B 是导致 CDAD 发生的原因。艰难梭菌中产生高水平毒素的菌株可引起 CDAD 发病率和死亡率升高。由于这些感染属于抗菌生物药物难治性感染，所以可能需要对此类患者进行结肠切除术。凡在使用抗生素后出现腹泻的患者，都必须考虑发生 CDAD 的可能性。曾有文献报道，在抗菌药物治疗结束 2 个月后发现 CDAD，因此在进行 CDAD 鉴别时需要认真了解患者的病史。

一旦怀疑或者确认患者发生了 CDAD，可能需要停止患者正在接受的抗生素（对艰难梭菌有直接抑制作用的抗生素除外）。同时应根据临床指征，对患者进行适当的液体和电解质管理、补充蛋白、使用抗生素治疗艰难梭菌感染并进行手术评估。

10. 长期或重复使用本品可导致耐药细菌或条件性致病真菌的共生或二次感染。

11. 使用本品期间，以硫酸铜法进行尿糖测定时可出现假阳性，用葡萄糖酶法者则不受影响。可使血清丙氨酸氨基转移酶或门冬氨酸氨基转移酶升高。

12. 注射用美洛西林钠与重金属，特别是铜、锌和汞呈配伍禁忌，因后者可破坏其氧化咪唑环。由锌化合物制造的橡皮管或瓶塞也可影响其活力。也可作为氧化剂、还原剂或羟基化合物灭活。

13. 应用大剂量时应定期检测血清清。

【孕妇及哺乳期妇女用药】本品可透过胎盘进入胎儿血液循环，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，因其应用后可能使婴儿致敏和引起腹泻、皮疹、念珠菌属感染等。

【儿童用药】未进行该项实验且无可靠参考文献。

【老年用药】通常，考虑到老年人较常出现肝、肾或心脏功能下降以及出现伴发病和合用其他药物治疗，使用本品时须调整剂量，监测肾功能有助于选择合理的剂量。

【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、吲哚美辛、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. 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。

4. 本品与大剂量肝素、口服抗凝剂和其他影响凝血系统和 / 或血小板功能的药物联合使用时，应提高定期监测凝血参数的检测频率。

5. 如果在手术期间或手术后立即使用本品，与非去极化型肌松药联合给药时，神经肌肉阻滞可能会加深或延长。这些相互作用可能会导致意外的、可能危及生命的事件。

6. 同时使用甲氧苄啶可能会导致甲氧苄啶水平升高。必要时应监测血浆水平。可能需要减少甲氧苄啶的剂量。

7. 在使用本品期间，即三酮样反应、非酶尿糖反应、尿胆素检测以及尿蛋白测定可能出现假阳性。基于溴酚蓝反应的蛋白质测定不受影响。

8. 本品可加强华法林的作用。

【药物过量】为防止过量用药引发的症状，对于严重肾功能损伤或严重肾功能损伤的患者必须减少剂量。和使用其它青霉素一样，如果个别病例在极高的血药浓度之后出现神经毒性反应，美洛西林钠可通过血液透析清除。

【药理学】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、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，对吲哚阳性变形杆菌、铜绿假单胞菌的抗菌活性强于羧苄西林和磺苄西林，对革兰阳性菌如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 53.4 μg/ml、152 μg/ml，1 小时后分别为 12.8 μg/ml、47.8 μg/ml，6 小时后已无法测得血药浓度，血消除半衰期 (t_{1/2α}) 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 86.5 μg/ml，1 小时后为 28.3 μg/ml，血消除半衰期 (t_{1/2α}) 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 ~ 1070 μg/ml，6 小时后仍保持 63.5 ~ 300 μg/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%，胆汁清除率变化较大，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 小时后可检出。在小儿脑膜炎病例中，脑脊液内药物浓度最高可达 23 μg/ml。小儿肌注，在静脉滴注 100mg/kg 后，胸水中最高浓度达到 6.3 μg/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 10 μg/ml。

【贮藏】密封，在凉暗干燥处（避光并不超过 20℃）保存。

【包装】西林瓶包装，4 支 / 盒。

【有效期】24 个月。

【执行标准】《中国药典》2020 年版第一增补本

【批准文号】国药准字 H37020221

【药品上市许可持有人】企业名称：新华制药（高密）有限公司

注册地址：山东省潍坊市高密市高密高新技术产业开发区高新二路（西）6 号

邮政编码：261505

联系电话：（0536）5609727

网 址：http: //www. xinhuaugao. com

【生产企业】企业名称：中孚药业股份有限公司

生产地址：山东省潍坊市寒亭区禹王北街 2709 号

邮政编码：261100

联系电话：（0536）2206826

网 址：http: //www. zhongfupharm. com

如有疑问，请与药品上市许可持有人直接联系。