核准日期：2021 年 4 月 7 日
修改日期：

注册商标

注射用头孢西丁钠说明书

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：注射用头孢西丁钠

英文名称：Cefoxitin Sodium for Injection

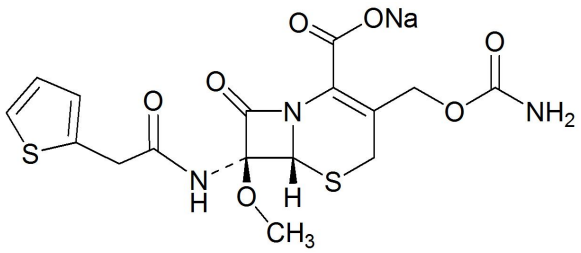
汉语拼音：Zhusheyong Toubaoxidingna

【成份】

本品主要成份为：头孢西丁钠。

化学名称：（6*R*，7*S*）-3-（氨基甲酰氧甲基）-7 -甲氧基-8-氧代-7-[2-（2-噻吩基）乙酰氨基]-5-硫杂-1-氮杂双环[4.2.0]辛-2-烯-2-羧酸钠盐。

化学结构式：



分子式：$C_{16}H_{16}N_3NaO_7S_2$

分子量：449.43

【性状】本品为白色或类白色粉末，吸湿性强。

【适应症】

为减少耐药细菌的产生并维持注射用头孢西丁及其它抗菌药的有效性，本品仅用于治疗或预防已被证实或强烈怀疑由敏感细菌所引起的感染。

治疗：本品适用于治疗由敏感细菌引起的下列严重感染：

1、下呼吸道感染：

由肺炎链球菌及其它链球菌〔不包括肠球菌，例如粪肠球菌（以前称粪链球菌）〕、金黄色葡萄球菌（包括产青霉素酶菌株）、大肠杆菌、肺炎克雷伯菌、流感嗜血杆菌以及拟杆菌属引起的下呼吸道感染，包括肺炎和肺脓肿。

2、泌尿道感染：

由大肠杆菌、肺炎克雷伯菌、奇异变形杆菌、摩根菌属、普通变形杆菌以及普罗维登氏菌属（包括 P.rettgeri）引起的泌尿道感染，包括无并发症的淋病。

3、腹腔内感染：

由大肠杆菌、克雷伯菌属、拟杆菌属（包括脆弱拟杆菌）以及梭菌属引起的腹膜炎和腹内脓肿。

4、妇科感染：

由大肠杆菌、淋病奈瑟氏菌（包括产青霉素酶菌株）、拟杆菌属（包括脆弱拟杆菌）、梭菌属黑色消化球菌、消化链球菌属和无乳链球菌引起的包括子宫内膜炎、盆腔蜂窝组织炎和盆腔炎。

注射用头孢西丁，类似头孢菌素，对沙眼衣原体没有活性。因此，本品用于治疗盆腔炎患者时，疑似有沙眼衣原体感染的，应适当合用抗衣原体药物。

5、败血症：

由肺炎链球菌、金黄色葡萄球菌（包括产青霉素酶菌株）、大肠杆菌、克雷伯菌属和拟杆菌属（包括脆弱拟杆菌）引起的败血症（包括伤寒）。

6、骨和关节感染：

由金黄色葡萄球菌（包括产青霉素酶菌株）引起的骨和关节感染。

7、皮肤和皮肤软组织感染：

由金黄色葡萄球菌（包括产青霉素酶菌株）、表皮葡萄球菌、化脓性链球菌等链球菌（不包括肠球菌，例如粪肠球菌（以前称粪链球菌））、大肠杆菌、奇异变形杆菌、克雷伯菌属、拟杆菌属（包括脆弱拟杆菌）、梭状芽胞杆菌属、黑色消化球菌和消化链球菌属引起的皮肤和皮肤软组织感染。

预防：注射用头孢西丁钠也可用于接受未污染的胃肠道手术，以及经阴道子宫切除、经腹腔子宫切除或剖腹（宫）产等手术前的预防感染。

【规格】按 $C_{16}H_{17}N_3O_7S_2$ 计　（1）0.5g　（2）1.0g

【用法用量】

肌内注射、静注或静脉滴注。

成人：成人常用量为 1～2g/次，每 6～8 小时一次。剂量应根据致病菌的敏感性、感染的严重程度及患者的病情调整剂量（见下表）

感染类型	每日总剂量	用法
单纯性感染（肺炎、泌尿系统感染、皮肤感染）	3～4g	每 6～8 小时 1g，肌注或静滴
中、重度感染	6～8g	每 4 小时 1g 或 6～8 小时 2g 静滴
需大剂量抗生素治疗的感染（例如气性坏疽）	12g	每 4 小时 2g 或 6 小时 3g 静滴

肾功能不全者则需按肌酐清除率调整剂量，按下表进行：

肾功能	肌酐清除率	剂量	用药次数
轻度损害	50～30ml/分	1～2g	8～12 小时一次
中度损害	29～10ml/分	1～2g	12～24 小时一次
重度损害	9～5ml/分	0.5～1.0g	12～24 小时一次
肾衰	＜5ml/分	0.5～1.0g	24～48 小时一次

儿童：3 个月及以上儿童患者的推荐剂量为按体重每天 80～160mg/kg，分 4～6 次按相等剂量给药，更高剂量应用于更严重的或者危重的感染，每天总剂量不得超过 12g。

从出生至 3 个月以内的婴儿患者，不宜使用本品。

对于肾功能不全的儿童患者，用法用量和用药频次应按照成人推荐剂量进行调整（见上表）。

预防用药：

成人：在未受污染的胃肠手术、经阴道子宫切除或经腹子宫切除，手术前 0.5～1 小时静脉滴注 2g，在第一次给药后，每 6 小时静滴 2g，给药不超过 24 小时。

剖宫产手术，在夹住脐带后静脉滴注 2g，在 4 小时和 8 小时后各加用给药一次剂量。

儿童：3 个月及以上儿童患者，推荐单次剂量为按体重 30～40mg/kg，于手术前 0.5～1 小时静脉滴注。

用药方法：

本品用于肌内注射，每克溶于 0.5%盐酸利多卡因 2ml；静注时，每克溶于 10ml 灭菌注射用水；静滴时，1～2g 头孢西丁钠溶于 50ml 或 100ml0.9%氯化钠注射液或 5%或 10%葡萄糖注射液中。

【不良反应】

注射用头孢西丁通常耐受性良好。最常见的不良反应是静脉注射后的局部反应，其它不

良反应很少遇到。

局部反应：静脉给药发生血栓性静脉炎。

过敏反应：已注意到皮疹（包括剥脱性皮炎和中毒性表皮坏死松解）、荨麻疹、潮红、瘙痒、嗜酸性粒细胞增多、发烧、呼吸困难和其它过敏反应包括过敏反应、间质性肾炎和血管性水肿。

心血管：低血压。

胃肠道：腹泻，包括在抗生素治疗期间或之后出现的所记录的假膜性结肠炎。恶心和呕吐很少报道。

神经肌肉：重症肌无力可能加重。

血液：嗜酸性粒细胞增多、白细胞减少包括粒细胞缺乏、中性粒细胞减少，贫血包括溶血性贫血、血小板减少症和骨髓抑制症。一些个体，尤其那些具有氮质血症的个体，可能进行阳性直接的 Coombs 测试。以及 ALT、AST、ALP、LDH、BUN 或血清 Cr 值一过性升高。

肝功能：SGOT，SGPT，血清 LDH 和血清碱性磷酸酶短暂升高，黄疸有报道。

肾功能：可见血清肌酐和/或血尿素氮水平升高。与头孢菌素一样，很少报道急性肾功能衰竭。注射用头孢西丁在肾功能改变的作用方面难以评估，因为导致肾前性氮血症或肾功能受损的诱因通常已经存在。

除上述注射用头孢西丁治疗患者所观察到的不良反应，关于头孢菌素类抗生素的不良反应和实验室测定结果改变的报道如下述：

荨麻疹、多形性红斑、史蒂文森-约翰逊综合征、血清病样反应、腹痛、结肠炎、肾功能不全、中毒性肾病、尿糖假阳性、肝功能障碍包括胆汁淤积、胆红素升高、再生障碍性贫血、出血，凝血酶原时间延长、全血细胞减少、粒细胞缺乏症、二重感染、阴道炎包括阴道念珠菌病。

已有几种头孢菌素可引起癫痫发作，特别是对于肾功能损伤的患者没有降低剂量使用时（见用法用量与给药途径）。如果发生药物相关性癫痫发作，应停药。根据临床指征可以给予抗惊厥治疗。

【禁忌】

对本品和头孢菌素类抗生素过敏患者禁用。

警告：在使用注射用头孢西丁治疗前，应仔细咨询以确定患者之前是否对头孢西丁、头孢菌素类、青霉素或其它药物有过敏反应。本品应谨慎给予青霉素敏感患者。抗生素类应谨慎给予已被证实具有某类过敏尤其是对药物过敏的患者。一旦发生对注射用头孢西丁的过敏反应，请停药。严重的过敏反应可使用肾上腺素和其它紧急措施。

几乎所有的抗菌素，包括头孢西丁，均有发生艰难梭菌相关性腹泻（CDAD）的报道，其严重程度从轻度腹泻至致命性的结肠炎。用抗菌剂治疗改变结肠的正常菌群，导致艰难梭菌过度生长。

艰难梭菌产生可以促进 CDAD 发生的毒素 A 和 B。产生艰难梭菌毒素的菌株升高发病率和致死率，而且这些感染可能为抗菌药难治性感染，因此可能需要结肠切除术。对所有使用抗生素后出现腹泻的患者必须考虑 CDAD。鉴于已有报告在给予抗菌剂两个月后发生 CDAD，因此需要谨慎关注病史。

如果 CDAD 被怀疑或证实，需要停止使用不直接针对艰难梭菌的抗生素。应按照临床指征开始适当的体液和电解质管理、蛋白质补充、针对艰难梭菌的抗生素治疗和手术评估。

【注意事项】

1、青霉素过敏者慎用。有青霉素过敏性休克史者不宜使用本品。一旦发生过敏性休克，需立即停药、就地抢救，保持呼吸道通畅，吸氧，给予肾上腺素、糖皮质激素及输液等紧急措施。

2、肾功能损害者慎用。肾功能减退和老年患者，需根据内生肌酐清除率调整给药剂量。

3、长期应用本品可引起肠道菌群失调，有胃肠道疾病史（特别是结肠炎）者慎用。

4、哺乳期妇女应用本品时应停止哺乳。

5、本品不宜用于出生至 3 个月以内的婴儿患者。

6、本品与氨基糖苷类抗生素配伍时，会增加肾毒性。

【孕妇及哺乳期妇女用药】

致癌性、诱变性和生育力减退：尚未使用头孢西丁对动物进行长期研究以评估潜在致癌性或诱变性。用 400mg/kg 头孢西丁（约为最大推荐人用剂量的 3 倍）静脉治疗大鼠的研究显示对生殖力或交配能力没有影响。

怀孕：以最大推荐人用剂量的大约一至七倍半的肠胃外给药剂量，在大鼠和小鼠中进行生殖毒性研究，未发现致畸或胚胎毒性作用，尽管观察到胚胎重量的轻微降低。

然而并没有关于孕妇的充足和优质的研究。因为动物生殖毒性研究并不总是能预测人类的反应，只有在明确需要时才在孕期使用这种药物。

在兔中，头孢西丁与流产和孕兔死亡率增高相关。这不被认为是致畸作用，这是兔对抗生素诱导的肠道微生物群落变化异常敏感性所致的一个可预期结果。

哺乳妇女：头孢西丁在人乳中低浓度排泄。当给予哺乳妇女注射用头孢西丁时应谨慎。

【儿童用药】

从出生到 3 个月儿童患者的安全性和有效性尚未确定。3 个月以上儿童患者中，嗜酸性粒细胞增多和血清谷草转氨酶升高与较高剂量使用注射用头孢西丁有关。

【老年用药】

在临床研究中接受头孢西丁治疗的 1775 例受试者中，424 例（24%）为 65 岁及以上，124 例（7%）为 75 岁及以上。在这些受试者和年轻受试者之间未观察到安全性或有效性的总体差异，并且其它临床经验报告中未发现老年和青年患者的有效性和安全性的差异，但是不能排除一些老年人存在更大敏感性。

已知该药物实质上经肾脏排泄，并且肾功能损伤患者对该药物的毒性反应的风险可能更高，因为老年患者肾功能降低的可能性更大，因此应注意剂量选择，监测肾功能可能是有益的（见用法用量、注意事项）。

【药物相互作用】

已有报道同时使用头孢菌素和氨基糖苷类抗生素，会增加肾毒性。药物/实验室测试相互作用：与头孢噻吩一样，高浓度的头孢西丁（＞100μg/ml）可能干扰 Jaffe 法检测的血清和尿肌酐水平，并导致报告的肌酐水平虚假上升。如果给药后 2 小时内取样，则不应分析用头孢西丁治疗患者的血清样品中肌酐水平。

尿液中高浓度的头孢西丁可能会干扰波特-西尔伯反应的尿液中 17-羟基-皮质类固醇的测定，并导致报告水平的虚假上升。

可能会发生尿液中葡萄糖的假阳性反应。这在用 CLINITEST*试剂片检查时可以观察到。

【药物过量】

成年雌性小鼠和兔子的急性静脉注射的 LD_{50} 分别为约 8.0g/kg 和大于 1.0g/kg。成年大鼠急性腹膜内 LD_{50} 大于 10.0g/kg。

长期大剂量使用可致菌群失调，产生二重感染，还可能引起维生素 K、维生素 B 族缺乏。

【药理毒理】

药理作用

作用机制：头孢西丁为通过抑制细菌细胞壁的合成而发挥作用的杀菌剂。在β-内酰胺酶（包括青霉素酶和头孢菌素酶）存在的情况下，头孢西丁对革兰阴性菌和革兰阳性菌仍具

有抗菌活性。

耐药机制：对头孢西丁的耐药性主要由β-内酰胺水解、青霉素结合蛋白（PBPs）的结构改变和渗透性降低所致。

下列临床常见革兰阳性、阴性需氧及厌氧致病菌对本品高度敏感。

需氧菌	**厌氧菌**
革兰阳性球菌	革兰阳性球菌
－葡萄球菌（包括凝固酶阳性、阴性和产青霉素酶的菌株）	－肠球菌
	－粪链球菌
－A 组乙型溶血性链球菌	－微需氧链球菌
－B 组乙型溶血性链球菌	
－肺炎链球菌	革兰阳性杆菌
－其它链球菌中 D 组链球菌	－产气荚膜梭状芽胞杆菌
革兰阴性球菌	－梭状芽胞杆菌
－淋病（奈瑟）菌	－真杆菌
－脑膜炎（奈瑟）菌	－痤疮丙酸杆菌
革兰阴性杆菌	革兰阴性球菌
－大肠埃希菌	－韦容球菌
－肺炎克雷伯杆菌	
－克雷伯杆菌属	尚有下列革兰阴性菌
－奇异变形杆菌	－脆弱拟杆菌
－变形杆菌（吲哚阳性）	－黑色素拟杆菌
普通变形杆菌	－类杆菌（包括青霉素敏感和青霉素耐药菌株）
摩根变形杆菌	
－流感嗜血杆菌	－梭杆菌
－粘质沙雷菌	
－普鲁威登菌	
－沙门杆菌及志贺菌	
注射用头孢西丁钠对下列细菌敏感度视菌株需作药敏试验而定。	
－不动杆菌属硝酸盐阴性杆菌	－粪产碱杆菌
－枸橼酸杆菌	－肠杆菌
头孢西丁钠对铜绿假单胞菌、肠球菌大多数菌株、阴沟杆菌等耐药。	

【药代动力学】

正常志愿者肌内注射 1g 后，20～30 分钟血药浓度达峰值为 24μg/ml。静注 1g 后，5 分钟血药浓度达峰值为 110μg/ml，4 小时后血药浓度低于 1μg/ml。静注后本品半衰期为 41～59 分钟，肌注后本品半衰期为 64.8 分钟。6 小时后约 85%药物以原型经肾脏排泄，肌注本品 1g 后，尿药浓度可达 3000μg/ml 以上。

本品在体内分布广泛，给药后可迅速进入各种体液，包括胸水、腹水、胆汁，但脑脊液穿透率较低，蛋白结合率为 80.7%。

注射用头孢西丁钠主要以原型从肾脏排泄，肾清除率包括肾小球滤过和肾小管排泄，给药后 6 小时相当于所给剂量 85%经肾从尿液中排出，血浆消除半衰期为 1 小时。

【贮藏】密封，在凉暗(避光并不超过 20℃)干燥处保存。

【包装】低硼硅玻璃管制注射剂瓶、注射用无菌粉末用覆聚酯膜溴化丁基橡胶塞和抗生素瓶用铝塑组合盖包装。每盒 1 瓶；每盒 10 瓶。

【有 效 期】24 个月

【执行标准】YBH03312021

【批准文号】0.5g：国药准字 H20213241

1.0g：国药准字 H20213240

【药品上市许可持有人】

名　　称：广州白云山医药集团股份有限公司白云山制药总厂

注册地址：广州市白云区同和街云祥路 88 号

【生产企业】

企业名称：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

药物警戒电话：（020）87062636

传　真 号 码：（020）87061075

网　址：http://www.byszc.com