

磺胺对甲氧嘧啶 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/309/2021_2022__E7_A3_BA_E8_83_BA_E5_AF_B9_E7_c22_309496.htm 药品名称磺胺对甲氧嘧啶 英文名称Sulfamethoxydiazine 类别磺胺类制剂本品为白色或微黄色片。0.5g 分子式成分化学名：N-(5-甲氧基-2-嘧啶基)-4-氨基苯磺酰胺。分子式

: C₁₁H₁₂N₄O₂S。分子量：280.31。药理毒理本品属长效磺胺药，其对非产酶金黄色葡萄球菌、化脓性链球菌、肺炎链球菌、大肠埃希菌、克雷伯菌属、沙门菌属、志贺菌属等肠杆菌科细菌、淋病奈瑟菌、脑膜炎奈瑟菌、流感嗜血杆菌具有抗菌作用。但近年来细菌对本品的耐药性增高，尤其是链球菌属、奈瑟菌属以及肠杆菌科细菌。本品的抗菌作用机制为在结构上类似对氨基苯甲酸(PABA)，可与PABA竞争性作用于细菌体内的二氢叶酸合成酶，从而阻止PABA作为原料合成细菌所需的叶酸，减少具有代谢活性的四氢叶酸的量，而后者则是细菌合成嘌呤、胸腺嘧啶核苷酸和脱氧核糖核酸(DNA)的必需物质，因此抑制了细菌的生长繁殖。药动学口服本品后迅速自胃肠道吸收，4~6小时达高峰血浓度，有效浓度维持较长，血消除半衰期(T_{1/2b})为37小时。血浆蛋白结合率为80%。本品可广泛分布于组织体液中，渗入脑脊液的药物浓度为血浓度的30%。本品主要从尿中排泄，排泄较缓慢，48小时由尿中排出给药量的57%。此外本品部分自皮肤、胆汁和乳汁排泄。由于本品在尿中溶解度较高(游离型和乙酰化物)，故结晶尿与血尿少见。本品的抗菌活性、吸收、排泄、血峰浓度、组织分布均优于磺胺嘧啶

和磺胺林。适应症敏感菌所致的尿路感染、慢性支气管炎、肠道感染和皮肤软组织感染。不良反应1.过敏反应较为常见。可表现为药疹，严重者可发生渗出性多形红斑、剥脱性皮炎和大疱表皮松解萎缩性皮炎等；也有表现为光敏反应、药物热、关节及肌肉疼痛、发热等血清病样反应。2.中性粒细胞减少或缺乏症、血小板减少症及再生障碍性贫血。患者可表现为咽痛、发热、苍白和出血倾向。3.溶血性贫血及血红蛋白尿。缺乏葡萄糖-6-磷酸脱氢酶(G-6PD)患者应用磺胺药后易发生，在新生儿和小儿中较成人为多见。4.高胆红素血症和新生儿核黄疸。由于磺胺药与胆红素竞争蛋白结合部位，可致游离胆红素增高。新生儿肝功能不完善，故较易发生高胆红素血症和新生儿黄疸，偶可发生核黄疸。5.肝脏损害。可发生黄疸、肝功能减退，严重者可发生急性肝坏死。6.肾脏损害。由于本品在尿中溶解度较高(游离型和乙酰化物)，故结晶尿与血尿少见。偶有患者发生间质性肾炎或肾小管坏死等严重不良反应。7.恶心、呕吐、胃纳减退、腹泻、头痛、乏力等。一般症状稍微，不影响继续用药。偶有患者发生艰难梭菌肠炎，此时需停药。8.甲状腺肿大及功能减退偶有发生。9.中枢神经系统毒性反应偶可发生，表现为精神错乱、定向力障碍、幻觉、欣快感或抑郁感。一旦出现均需立即停药。磺胺药所致的严重不良反应虽少见，但可致命，如渗出性多形红斑、剥脱性皮炎、大疱表皮松解萎缩性皮炎、暴发性肝坏死、粒细胞缺乏症、再生障碍性贫血等血液系统异常。治疗时应严密观察，当皮疹或其他反应的早期征兆出现时即应立即停药。相互作用1.合用尿碱化药可增强本品在碱性尿中的溶解度，使排泄增多。2.不能与对氨基苯甲

酸(PABA)合用，因PABA可代替本品被细菌摄取，两者相互拮抗。 3.下列药物与本品同用时，本品可取代这些药物的蛋白结合部位，或抑制其代谢，以致药物作用时间延长或毒性发生，因此当这些药物与磺胺药同时应用，或在应用本品之后使用时需调整其剂量。此类药物包括口服抗凝药、口服降血糖药、甲氨蝶呤、苯妥英钠和硫喷妥钠。 4.与骨髓抑制药合用时可能增强此类药物对造血系统的不良反应。如有指征需两类药物同用时，应严密观察可能发生的毒性反应。 5.与避孕药(雌激素类)长时间合用可导致避孕的可靠性减小，并增加经期外出血的机会。 6.与溶栓药物合用时，可能增大其潜在的毒性作用。 7.与肝毒性药物合用，可能引起肝毒性发生率的增高。对此类患者尤其是用药时间较长及以往有肝病史者应监测肝功能。 8.与光敏感药物合用时可能发生光敏感的相加作用。 9.接受本品治疗者对维生素K的需要量增加。 10.不宜与乌洛托品合用，因乌洛托品在酸性尿中可分解产生甲醛，后者可与本品形成不溶性沉淀物，使发生结晶尿的危险性增加。 11.本品可取代保泰松的血浆蛋白结合部位，当两者同用时可增强保泰松的作用。 12.磺吡酮(sulfipyrazone)与本品合用时可减少后者自肾小管的分泌，导致血药浓度升高且持久，从而产生毒性，因此在应用磺吡酮期间或应用后可能需要调整本品的剂量。当磺吡酮疗程较长时，对磺胺药的血药浓度宜进行监测，有助于剂量的调整，保证安全用药。

用法用量成人口服：首次1g，以后一次0.5g，一日1次。 #093. 磺胺血浓度不应超过200 μg/ml，超过此浓度，不良反应发生率增高，毒性增强。 注重事项对磺胺类药物过敏者禁用。由于本品阻止叶酸的代谢，加重巨幼红细胞性贫血患者叶酸盐

的缺乏，所以该病患者禁用本品。孕妇及哺乳期妇女禁用本品。小于2个月的婴儿禁用本品。重度肝肾功能损害者禁用本品。

- 1.交叉过敏反应。对一种磺胺药呈现过敏的患者对其他磺胺药也可能过敏。
- 2.肝脏损害。可发生黄疸、肝功能减退，严重者可发生急性肝坏死。故有肝功能损害患者宜避免磺胺药的全身应用。
- 3.肾脏损害。如应用本品疗程长，剂量大时宜同服碳酸氢钠并多饮水，以防止此不良反应。失水、休克和老年患者应用本品易致肾损害，应慎用或避免应用本品。肾功能减退患者不宜应用本品。
- 4.对呋塞米、砒类、噻嗪类利尿药、磺脲类、碳酸酐酶抑制药呈现过敏的患者，对磺胺药亦可过敏。
- 5.下列情况应慎用：缺乏G-6PD、血卟啉症患者。
- 6.治疗中须注重检查：
 - (1)全血象检查，对接受较长疗程的患者尤为重要。
 - (2)治疗中定期尿液检查(每2~3日查尿常规一次)以发现长疗程或高剂量治疗时可能发生的结晶尿。
 - (3)肝、肾功能检查。

#093. 1.本品可穿过血胎盘屏障至胎儿体内，动物实验发现有致畸作用。人类研究缺乏充足资料，孕妇宜避免应用。

- 2.本品可自乳汁中分泌，乳汁中浓度可达母体血药浓度的50%~100%，药物可能对乳儿产生影响。本品在G-6PD缺乏的新生儿中的应用有导致溶血性贫血发生的可能。鉴于上述原因，哺乳期妇女不宜应用本品。

#093.由于磺胺药可与胆红素竞争在血浆蛋白上的结合部位，而新生儿的乙酰转移酶系统未发育完善，磺胺游离血浓度增高，以致增加了核黄疸发生的危险性，因此该类药物在新生儿及2个月以下婴儿的应用属禁忌；由于儿童处于生长发育期，肝肾功能还不完善，用药量应酌减。

#093.老年患者应用磺胺药发生严重不良反应的机会增加。如严重皮疹、骨髓抑制和血小板减

少等是老年人严重不良反应中常见者。因此老年患者宜避免应用，确有指征时需权衡利弊后决定。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com