

依托红霉素 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文  
[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/311/2021\\_2022\\_\\_E4\\_BE\\_9D\\_E6\\_89\\_98\\_E7\\_BA\\_A2\\_E9\\_c22\\_311138.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/311/2021_2022__E4_BE_9D_E6_89_98_E7_BA_A2_E9_c22_311138.htm) 药品名称依托红霉素  
药物别名无味红霉素、Estolate 英文名称Erytrom 类别大环内酯类制剂片剂：0.125g；胶囊：0.05g、0.125g；颗粒剂：75m  
分子式成分药理毒理本品为大环内酯类抗生素，抗菌谱和青霉素相似，主要是对革兰阳性菌如金葡菌、溶血性链球菌、肺炎球菌、白喉杆菌、炭疽杆菌及梭形芽胞杆菌等，均有强大抗菌作用。对革兰阴性菌如脑膜炎双球菌、淋球菌、百日咳杆菌、流感杆菌、布氏杆菌、部分痢疾杆菌及大肠杆菌等有一定作用。特点是对青霉素产生耐药性的菌株，对本品敏感。作用机制主要是与核糖核蛋白体的50S亚单位相结合，抑制肽酰基转移酶，影响核糖核蛋白体的移位过程，妨碍肽链增长，抑制细菌蛋白质的合成，系抑菌剂。具体见下：本品属大环内酯类抗生素，为红霉素丙酸酯的十二烷基硫酸盐，对葡萄球菌属、各组链球菌和革兰阳性杆菌均具抗菌活性。奈瑟菌属、流感嗜血杆菌、百日咳鲍特氏菌等也可对本品呈现敏感。本品对除脆弱拟杆菌和梭杆菌属以外的各种厌氧菌亦具抗菌活性；对军团菌属、胎儿弯曲菌、某些螺旋体、肺炎支原体、立克次体属和衣原体属也有抑制作用。本品系抑菌剂，但在高浓度时对某些细菌也具杀菌作用。本品可透过细菌细胞膜，在接近供位（P位）处与细菌核糖体的50S亚基成可逆性结合，阻断了转移核糖核酸（t-RNA）结合至P位上，同时也阻断了多肽链自受位（A位）至P位的位移，因而细菌蛋白质合成受抑制。本品仅对分裂活跃的细菌有效。药动学口服后tmax 4h，分布于多数组织和体液，主要在肝中浓缩

，分泌进入胆汁，胆汁中浓度较高，经肾脏排出很少。 $t_{1/2}$ 为1.6h(1.2~2.6h)，肝功能障碍者，须及时调整剂量。琥乙红霉素吸收总量较依托红霉素少，血药浓度亦较低。具体见下：

：口服剂：空腹或饭后口服都很快吸收，在胃酸中较稳定。蛋白结合率为90%~99%。口服后在胃肠道中分解为红霉素丙酸酯，部分在血液中水解成游离的红霉素而起抗菌作用。口服0.25g和0.5g的血药峰浓度( $C_{max}$ )于2小时到达，分别为1.4mg/L和4.2mg/L。吸收后除脑脊液和脑组织外，广泛分布于各组织和体液中，尤以肝、胆汁和脾中的浓度为最高，在肾、肺等组织中的浓度可高出血药浓度数倍，在胆汁中的浓度可达血药浓度的10%~40倍以上。在皮下组织、痰及支气管分泌物中的浓度也较高，痰中浓度与血药浓度相仿；在胸、腹水、脓液等中的浓度可达有效水平。本品有一定量（约为血药浓度的33%）进入前列腺及精囊中，但不易透过血-脑脊液屏障，脑膜有炎症时脑脊液中浓度仅为血药浓度的10%左右。可进入胎血和排入母乳中，胎儿血药浓度为母体血药浓度的5%~20%，母乳中药物浓度可达血药浓度的50%以上。表观分布容积( $V_d$ )为0.9L/kg。游离红霉素在肝内代谢，血消除半衰期( $t_{1/2b}$ )为1.4~2小时，无尿患者的血半衰期可延长至4.8~6小时。红霉素主要在肝中浓缩和从胆汁排出，并进行肠肝循环，约2%~5%的口服量和10%~15%的注入量自肾小球滤过排除，尿中浓度可达10~100mg/L。粪便中也含有一定量。血或腹膜透析后极少被清除，故透析后无需加用。

适应症1．本品作为青霉素过敏患者治疗下列感染的替代用药：溶血性链球菌、肺炎链球菌等所致的急性扁桃体炎、急性咽炎、鼻窦炎；溶血性链球菌所致的猩红热、蜂窝织炎；白喉及

白喉带菌者；气性坏疽、炭疽、破伤风；放线菌病；梅毒；李斯特菌病等。2．军团菌病。3．肺炎支原体肺炎。4．肺炎衣原体肺炎。5．其他衣原体属、支原体属所致泌尿生殖系感染。6．沙眼衣原体结膜炎。7．厌氧菌所致口腔感染。8．空肠弯曲菌肠炎。9．百日咳。10．风湿热复发、感染性心内膜炎（风湿性心脏病、先天性心脏病、心脏瓣膜置换术后）、口腔、上呼吸道医疗操作时的预防用药（青霉素的替代用药）。不良反应胃肠道刺激，如腹上区不适、胃绞痛、恶心、呕吐及腹泻等。偶可引起皮疹、药物热、嗜酸细胞增多等变态反应。偶可引起胆汁郁积性肝炎综合征，表现为恶心、呕吐、右上腹痛，继以黄疸、发热和提示胆汁郁积性肝炎的肝功能改变，以依托红霉素多见，停药后可恢复。罕见神经性耳聋。静脉注射易引起静脉炎。相互作用可升高茶碱、卡马西平、华法令、环孢素、三唑仑、甲泼尼松、地高辛等血药浓度，须监测相应药物血药浓度。与酒石酸麦角胺(ergotamine tartrate)合用，可致急性麦角胺中毒，表现为末梢血管痉挛。不宜与繁殖期杀菌剂(如 内酰胺类抗生素)同时应用，若确系必需，须相隔数小时。注射剂不宜与复合维生素B、维生素C、头孢菌素、四环素、多粘菌素E (colistin)、氯霉素、肝素、间羟胺、苯妥英等配伍。具体见下：1．本品可抑制卡马西平和丙戊酸等抗癫痫药的代谢，导致后者血药浓度增高而发生毒性反应。本品与阿芬太尼合用可抑制后者的代谢，延长其作用时间。本品与阿司咪唑或特非那定等抗组胺药合用可增加心脏毒性，与环孢素合用可使后者血药浓度增加而产生肾毒性。2．与氯霉素和林可酰胺类有拮抗作用，不推荐同用。3．本品为抑菌剂，可干扰青霉素的

杀菌效能，故当需要快速杀菌作用如治疗脑膜炎时，两者不宜联合用药。4．长期服用华法林的患者应用本品时可导致凝血酶原时间延长，从而增加出血的危险性，老年病人尤应注重。两者必须同用时，华法林的剂量宜适当调整，并严密观察凝血酶原时间。5．除二羟丙茶碱外，本品与黄嘌呤类合用可使氨茶碱的肝清除减少，导致血清氨茶碱浓度升高和（或）毒性反应增加。这一现象在合用6日后较易发生，氨茶碱清除的减少幅度与本品血清峰值成正比。因此在两者合用疗程中和疗程后，黄嘌呤类的剂量应予调整。6．与其他肝毒性药物合用可能增强肝毒性。7．大剂量本品与耳毒性药物合用，尤其肾功能减退患者可能增加耳毒性。8．与洛伐他丁合用时可抑制其代谢而使血浓度上升，可能引起横纹肌溶解，与咪达唑仑或三唑仑合用时可减少二者的清除而增强其作用。用法用量以红霉素碱基计。口服：成人，1g～2g/日，3～4次/日；儿童，每日30mg～50mg/kg，3～4次/日。注重事项妊娠B类，妊娠和哺乳期妇女慎用，过敏者禁用，有肝病或肝功失常患者慎用。本品不宜单独用于严重葡萄球菌感染。不宜肌内注射给药，滴注速度宜慢。红霉素片剂为肠溶片，不可嚼碎。腹膜透析和血液透析不能清除本品。1．服用本品后出现ALT、AST、AKP、胆红素等增高者较服用其他红霉素制剂为多见。2．溶血性链球菌感染用本品治疗时，至少需持续10日，以防止急性风湿热的发生。3．肾功能减退患者一般无需减少用量。4．患者对一种红霉素制剂过敏或不能耐受时，对本品也可过敏或不能耐受。5．慢性肝病、肝功能损害者慎用。6．因不同细菌对红霉素的敏感性存在一定差异，故应做药敏测定。7．对诊断的干扰：红霉素

可干扰Higerty法的荧光测定，使尿儿茶酚胺的测定值出现假性增高。血清碱性磷酸酶、胆红素、丙氨酸氨基转移酶和门冬氨酸氨基转移酶的测定值均可能增高。【孕妇及哺乳期妇女用药】1．本品可通过胎盘而进入胎儿循环，且孕妇服用本品后出现肝毒性反应的可能性增加，故孕妇不宜应用。2．红霉素有相当量进入母乳中，哺乳期妇女应用时宜暂停哺乳。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](http://www.100test.com)