

药物分析 美罗培南药师资格考试 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/538/2021_2022__E8_8D_AF_E7_89_A9_E5_88_86_E6_c23_538508.htm 药理：本品为细菌细胞壁合成抑制剂。体外比较本品和Imipenem、Cefotaxime（头孢噻肟）及Ceftazidime（头孢他定），发现本品对革兰氏阴性菌抑制作用最强。它的抗菌谱包括所有肠杆菌科的细菌（99.7%对本品小于4 μg/ml浓度药物敏感）、假单胞菌属和不动杆菌属。对革兰氏阴性菌的作用强度和抗菌谱不及Imipenem，但优于Ceftazidime（头孢他定）。本品浓度0.5 μg/ml时可抑制90%的金黄色葡萄球菌、肺炎双球菌和溶血链球菌等。本品对厌氧菌的作用强于Metronidazol（甲硝唑）和Clindamycin（氯洁霉素）。本品对肠杆菌科特别有效，MIC₉₀均小于或等于0.125 μg/ml，抗普通变形菌、奇异变形菌和摩氏摩根菌的MIC₉₀，本品为0.125 μg/ml，而Imipenem为4 μg/ml。本品容易透入大肠杆菌和绿脓杆菌，对大肠杆菌的渗透性更强。

药动学 本品在大鼠、狗和猴等动物体内分布快速、广泛，在肾和其它血流充沛的组织中浓度较高。血浆清除半衰期在大鼠体内为6分钟，猴体内为30分钟，狗体内为45分钟，人体内为1小时。在各种试验对象中，本品24小时内尿排除量为90%~100%，主要以原形药或开环的β-内酰胺代谢物形式排泄。本品不同剂量的药动学方式基本相同，多剂量研究未见药物蓄积。30位志愿者单剂量（250mg、500mg、1000mg）和多剂量（500mg/12h、1000mg/12h）输注本品，输注250mg、500mg和1000mg后立即测得的血浆药物浓度分别为15.8 μg/ml、26.9 μg/ml和53.1 μg/ml，血浆半衰期1小时，尿中回

收率为54.3% ~ 64.2%。适应症：用于治疗下呼吸道、尿路、腹内、妇科和皮肤感染以及细菌性脑膜炎等。用法用量：应用本品原则上不可超过2周。最初三日给药后观察是否有效，以决定是否继续给药或更换其它药物。通常成人1日0.5 ~ 1.0g，分2 ~ 3次，静脉点滴，每次30分钟以上。可按年龄、病情增减剂量。重症，顽固性感染可增至1日2g。使用时用生理盐水或5%葡萄糖注射液溶解，每0.5g本品稀释到100ml以上，不用注射用水稀释。[制剂与规格]静脉注射剂：250mg，500mg，1000mg；肌肉注射剂：500mg. 禁用慎用：对于不同程度肾损害病人，肌酐清除率下降，本品剂量应相应减少。新生儿、婴儿与成年人相比，本品的分布体积增加，清除下降，半衰期延长，因此剂量应当调整。不良反应：人对本品的耐受性好，副作用（如恶心和腹泻）短暂、温和，发生率低。相互作用：丙磺舒可使本品 $t_{1/2}$ 延长。"#F8F8F8"

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