**苄星青霉素**

文章版本号：2

最后发布时间：2014-4-15 9:46:13

**【特别警示】**

本药禁用于静脉注射，据报道静脉误注射后可造成心脏停搏和呼吸停止。(FDA药品说明书-苄星青霉素混悬注射液)

**【药物名称】**

中文通用名称：苄星青霉素

英文通用名称：Benzathine Benzylpenicillin

其他名称：安唐西林、比西林、苄星青、苄星青霉素G、长效青霉素、长效西林、二苄乙二胺青霉素、唐西灵、Benzathine Benzylpenicillin G、Benzathine Penicillin、Benzathinum Benzylpenicillinum、Bicillin、Bicillin L-A、Dulcepen-G、Extencilline、Neolin、Penicillin G Benzathine、Permapen、Tardocillin。

**【药理分类】**

抗感染药>>抗生素>>青霉素类>>半合成青霉素

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

1.主要用于预防风湿热复发。

2.用于控制链球菌感染的流行。

**其他临床应用参考**

1.用于预防风湿性舞蹈病。(FDA批准适应症)

2.用于治疗品他病。(FDA批准适应症)

3.用于雅司病。(FDA批准适应症)

4.用于治疗急性中耳炎、猩红热、梅毒。

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·预防风湿热复发、控制链球菌感染的流行

1.肌内注射  一次60万-120万U，每2-4周1次。

◆老年人剂量

老年人需调整用药剂量。

**儿童**

◆常规剂量

·预防风湿热复发、控制链球菌感染的流行

1.肌内注射  一次30万-60万U，每2-4周1次。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·预防风湿热复发

1.肌内注射  一次120万U，一个月1次；或一次60万U，每2周1次。也有以下用法用量：一次120万U，每4周1次，高风险患者可每3周1次。

·预防风湿性舞蹈病

1.肌内注射  一次120万U，一个月1次；或一次60万U，每2周1次。

·链球菌性咽炎、品他病、雅司病

1.肌内注射  单次120万U。

·梅毒

1.肌内注射  (1)非性病性梅毒：单次120万U。(2)一期、二期和早期潜伏梅毒：单次240万U。(3)晚期潜伏梅毒或不能确定病期的潜伏梅毒以及神经梅毒：一次240万U，每隔1周1次，共3剂，总剂量为720万U。

◆肾功能不全时剂量

轻度肾功能不全(肾小球滤过率大于50ml/min)者，无需调整剂量；中度肾功能不全(肾小球滤过率为10-50ml/min)者，用药剂量降至青霉素G常规剂量的75%；重度肾功能不全(肾小球滤过率小于10ml/min)者，用药剂量降至青霉素G常规剂量的20%-50%。

◆老年人剂量

多次大剂量使用青霉素G的老年患者可根据其肾功能状态调整剂量。

◆透析时剂量

血液透析结束后可给予维持剂量；连续性非卧床腹膜透析者使用青霉素G的剂量应降至常规剂量的20%-50%，每6小时1次；连续性动静脉血液滤过者使用青霉素G的剂量应降至常规剂量的75%，每6小时1次。

**儿童**

◆常规剂量

·预防风湿热复发

1.肌内注射  (1)小于或等于27kg者：一次60万U，每4周1次，高风险患者可每3周1次。(2)大于27kg者：一次120万U，每4周1次，高风险患者可每3周1次。

·链球菌性咽炎

1.肌内注射  (1)小于或等于27kg者：单次30-60万U。(2)大于27kg者：单次90万U；也可单次120万U。

·梅毒

1.肌内注射  (1)先天性梅毒：小于2岁者，单次5万U/kg。(2)一期、二期和早期潜伏梅毒：单次5万U/kg(最大240万U)。(3)晚期潜伏梅毒或不能确定病期的潜伏梅毒：一次5万U/kg(最大240万U)，每隔1周1次，共3剂，总剂量为15万U/kg(最大总剂量为720万U)。

◆肾功能不全时剂量

轻度肾功能不全(肾小球滤过率大于50ml/min)者，无需调整剂量；中度肾功能不全(肾小球滤过率为10-50ml/min)者，用药剂量降至常规剂量的75%；重度肾功能不全(肾小球滤过率小于10ml/min)者，用药剂量降至常规剂量的25%-50%(一日最大剂量为400万-600万U)。

◆透析时剂量

血液透析结束后(非腹膜透析时)可给予维持剂量。

**【给药说明】**

**注射液的配制**

本药肌内注射液需新鲜配制，临用前加适量灭菌注射用水使成混悬液后进行肌内注射。

**【禁忌症】**

对青霉素类药过敏或有过敏史者。

**【慎用】**

1.有哮喘、湿疹、花粉症、荨麻疹等过敏性疾病者。

2.严重肾功能损害者。

3.有癫痫发作史者(国外资料)。

4.老年人。

**【特殊人群】**

**儿童**

本药局部刺激症状较强，一般不宜用于婴儿。

**老人**

老年患者慎用。

**妊娠期妇女**

1.动物生殖试验尚未发现青霉素可引起胎儿损害，但尚缺乏妊娠期妇女用药的严格对照试验，故妊娠期妇女仅在确有必要时方可使用本药。

2.美国食品药品管理局(FDA)对本药的妊娠安全性分级为B级。

**哺乳期妇女**

少量的本药可随乳汁排泄，故哺乳期妇女用药时应暂停哺乳。

**特殊疾病状态**

有癫痫发作史者：高血药浓度(特别是有肾损害患者)可能会增加癫痫发作的风险，有癫痫发作史者慎用本药。

**【不良反应】**

1.肝脏  多数患者用药后可出现血清丙氨酸氨基转移酶或天门冬氨酸氨基转移酶升高。

2.过敏反应  用药后可发生青霉素引起的各种过敏反应，其中以皮疹等过敏反应为多见，白细胞减少、间质性肾炎、哮喘发作和血清病型反应等少见，严重者如过敏性休克偶见。

3.其他  可出现耐青霉素金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌或念珠菌的二重感染以及注射部位疼痛、压痛等局部刺激症状。少数患者用药后出现低度发热，但可在24-48小时内自行消失。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.丙磺舒、阿司匹林、吲哚美辛、保泰松、磺胺类药物：

结果：合用可使本药的血清半衰期延长。

机制：以上药物可减少本药自肾小管分泌。

2.华法林：

结果：与青霉素合用可能会增强华法林的抗凝作用。

3.抑菌药物(四环素、红霉素、氯霉素等)：

结果：合用可减弱本药的抗菌作用。

机制：相互拮抗。

**【注意事项】**

**用药警示**

1.用药前须详细询问患者病史，包括用药史、过敏反应史、有无易被患者忽略的症状(如胸闷、瘙痒、面部发麻、发热)以及有无家族变态反应疾病史。

2.本药仅作肌内注射。注入动脉或神经(或在其附近注射)可能会导致严重的神经血管损伤或永久性的神经损伤。

**交叉过敏**

对一种青霉素类药过敏者可能对其他青霉素类药、青霉胺或头孢菌素类药过敏。

**皮肤过敏试验**

用药前必须先作青霉素皮肤敏感试验。皮试液浓度为500U/ml，皮内注射0.05-0.1ml。阳性反应者禁用本药。

**不良反应的处理方法**

用药期间一旦发生过敏性休克，必须就地抢救，保持气道畅通、吸氧，并使用肾上腺素、糖皮质激素等进行治疗。

**药物对检验值或诊断的影响**

以硫酸铜法进行尿糖测定时可呈假阳性，用葡萄糖酶法测定则不受影响。

**【国外专科用药信息参考】**

**精神状况信息**

对精神状态的影响：本药可能会引起困倦或意识模糊，但极罕见；有青霉素类药引起恐惧、幻想、幻觉、人格障碍、激越、失眠和脑病的报道。

**护理注意事项**

1.开始治疗前应评估细菌培养和药物敏感性测定报告以及患者的药物过敏史。

2.监测有无超敏反应和机会性感染。

3.首剂给药期间应监测有无过敏反应的症状和体征。

**【药理】**

**药效学**

本药为青霉素G的二苄基乙二胺盐，是一种青霉素G的长效制剂，其活性成分为青霉素。作用特点是给药后吸收缓慢，血药浓度较低而维持时间较长。

◆作用机制  与青霉素G相同，本药的作用机制为干扰细菌细胞壁的生物合成而发挥抗菌作用。

◆抗菌谱  对溶血性链球菌、不产青霉素酶的金黄色葡萄球菌、敏感的肺炎链球菌等革兰阳性球菌以及脑膜炎奈瑟菌、淋病奈瑟菌等革兰阴性球菌具有较强的抗菌活性。

对本药敏感的微生物还有：白喉棒状杆菌、炭疽芽孢杆菌、厌氧破伤风梭状芽孢杆菌、产气荚膜梭状芽孢杆菌、肉毒梭状芽孢杆菌、放线菌属、真杆菌属、丙酸杆菌等革兰阳性杆菌，螺旋体(梅毒螺旋体、回归热螺旋体、钩端螺旋体等)及个别阴性杆菌(如嗜血杆菌属)。

**药动学**

本药对胃酸稳定，但从胃肠道吸收不完全，口服后血药浓度较低。肌内注射后，药物自局部缓慢释放，水解成青霉素G，血药浓度虽然较低，但可维持2-4周。

成人肌内注射本药240万U，14日后血清浓度为0.12μg/ml；新生儿肌内注射5万U，13-24小时达血药峰浓度，为1.23μg/ml，4日和12日后血药浓度分别为0.65-0.92μg/ml和0.07-0.09μg/ml；儿童肌内注射60万U、120万U，24小时后达血药峰浓度，分别为0.16μg/ml、0.15μg/ml，给药后18日，血药浓度为0.01μg/ml。

本药吸收后可广泛分布于各组织、体液中。药物主要随尿液排泄，另有少量随胆汁排泄。

**遗传、生殖毒性与致癌性**

◆遗传毒性  尚无本药致突变性的动物研究数据。

◆生殖毒性  动物生殖毒性试验尚未发现本药可引起胚胎损害。

◆致癌性  尚无本药致癌性的动物研究数据。

**【制剂与规格】**

注射用苄星青霉素  (1)30万U。(2)60万U。(3)120万U。

**【贮藏】**

粉针剂：密封，在干燥处保存。

使用UpToDate临床顾问须遵循[用户协议](http://www.uptodate.com/contents/license)。

专题 92332 版本 1.0