**头孢克洛**

文章版本号：2

最后发布时间：2014-4-15 9:46:10

**【药物名称】**

中文通用名称：头孢克洛

英文通用名称：Cefaclor

其他名称：赐福乐素、单水头孢氯氨苄、迪素、恒迪克、恒运、可福乐、克林社福、克赛福、立特罗、龙威欣、氯氨苄头孢菌素、氯头孢菌素、曼宁、欧佳、申洛、胜寒、施华洛、史达功、帅先、苏刻乐、通远立克、头孢克罗、头孢克罗单水化物、头孢氯氨苄、万敏新、希刻劳、希诺、希优洛、喜福来、欣可定、欣可诺、新达罗、一水头孢克洛、再克、Alfatil、Ceclor、Cefaclor Monohydrate、Cefaclorum、Cleancef、Distaclor、Keflor、Kefolor、Kefral、Kloclor、L-Kefral、Panacef、Panoral、Xincatlor、ZAIKE。

**【药理分类】**

抗感染药>>抗生素>>头孢菌素类>>第二代头孢菌素

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

适用于敏感菌所致下列部位的轻、中度感染：

1.呼吸系统感染，如扁桃体炎、咽喉炎、支气管炎、肺炎、扁桃体周围炎、支气管肺炎、哮喘和支气管扩张伴感染。

2.泌尿生殖系统感染，如前列腺炎、肾盂肾炎、膀胱炎、淋球菌性尿道炎。

3.皮肤、软组织感染，如毛囊炎、疖、丹毒、蜂窝组织炎、脓疱病、痈、痤疮感染、皮下脓肿、创伤感染。

4.口腔感染，如上颌骨周围炎、上颌骨骨膜炎、上颌骨骨髓炎、急性腭炎、牙槽脓肿、根尖性牙周炎、智齿周围炎、拔牙后感染。

5.眼部感染，如睑腺炎、睑炎、急性泪囊炎。

6.耳鼻喉感染，如中耳炎、鼻窦炎、外耳炎。

7.其他感染，如胆道感染、手术后感染、乳腺炎、淋巴管炎。

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·抗感染

1.口服给药  (1)非缓释制剂：常用量为一次250mg，一日3次，宜空腹给药；重症感染或敏感性较差的细菌引起的感染，剂量可加倍，但一日总量不超过4g。(2)缓释制剂：常用量为一次375-750mg，一日2次，于早、晚餐后服用。

◆肾功能不全时剂量

轻度肾功能不全者可不减量；中、重度肾功能不全者的剂量应分别减为正常剂量的1/2和1/4。

◆老年人剂量

老年患者除虚弱、营养不良或严重肾功能损害外，一般不需调整剂量。

**儿童**

◆常规剂量

·抗感染

1.口服给药  (1)非缓释制剂：常用量为一日20mg/kg，分3次给药，宜空腹服用；重症感染可增至一日40mg/kg，但一日总量不超过1g。(2)缓释制剂：体重20kg以上儿童，用法用量同成人。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·咽炎、扁桃体炎

1.口服给药  缓释剂，一次375mg，每12小时1次，连用10日。普通制剂，一次250-500mg，每8小时1次。

·慢性支气管炎急性发作期、急性支气管炎

1.口服给药  缓释剂，一次500mg，每12小时1次，连用7日。

·囊性肺纤维化

1.口服给药  一次250-500mg，每8小时1次。

·下呼吸道感染、泌尿道感染

1.口服给药  普通制剂，一次250-500mg，每8小时1次。

·皮肤和(或)皮下组织感染

1.口服给药  缓释剂，一次375mg，每12小时1次，连用7-10日。普通制剂，一次250-500mg，每8小时1次。

·急性中耳炎

1.口服给药  普通制剂，一次250-500mg，每8-12小时1次。

◆肾功能不全时剂量

对肾功能不全者的用量，推荐按肌酐清除率(Ccr)作以下调整：Ccr为10-50ml/min时，使用正常剂量的50%-100%；Ccr低于10ml/min时，使用正常剂量的50%。

◆老年人剂量

肌酐清除率正常的老年人无需调整剂量。

◆透析时剂量

对于接受血液透析的患者，应在血液透析后给予250mg，接受持续性腹膜透析的患者，应每8-12小时给予250mg。

**儿童**

◆常规剂量

·咽炎、扁桃体炎

1.口服给药  一个月及以上儿童，普通制剂，一日20-40mg/kg，分次服用(每8-12小时1次)，最大日剂量为1g。16岁及16岁以上儿童，缓释剂，一次375mg，每12小时1次，连用10日。

·慢性支气管炎急性发作期、急性支气管炎

1.口服给药  16岁及16岁以上儿童，同成人。

·囊性肺纤维化

1.口服给药  一次10-15mg/kg，每8小时1次。

·下呼吸道感染

1.口服给药  普通制剂，一日20-40mg/kg，分3次服用(每8小时1次)，最大日剂量为1g。

·泌尿道感染

1.口服给药  一个月及以上儿童，普通制剂，一日20-40mg/kg，分3次服用(每8小时1次)，最大日剂量为1g。

·皮肤和(或)皮下组织感染

1.口服给药  一个月及以上儿童，普通制剂，一日20-40mg/kg，分3次服用(每8小时1次)，最大日剂量为1g。16岁及16岁以上儿童，缓释剂，一次375mg，每12小时1次，连用7-10日。

·急性中耳炎

1.口服给药  一个月及以上儿童，普通制剂，一日40mg/kg，分3次服用(每8小时1次)，最大日剂量为1g。

◆肾功能不全时剂量

参见成人“肾功能不全时剂量”。

**【禁忌症】**

对本药或其他头孢菌素类药过敏者。

**【慎用】**

1.对青霉素类、青霉素衍生物或青霉胺过敏者及对青霉素类抗生素有过敏史者。

2.严重肾功能不全者(用药中应监测血药浓度)。

3.有胃肠道疾病史者，特别是溃疡性结肠炎、克罗恩病或抗生素相关性肠炎患者。

4.口服吸收不良、非经口营养或全身状况不良的患者。

5.肝功能损害者。

6.高龄者。

7.妊娠期妇女及可能妊娠的妇女。

8.哺乳期妇女。

**【特殊人群】**

**儿童**

新生儿用药的安全性及有效性尚不明确。16岁以下儿童不应使用长效缓释片。

**老人**

老人用药参见“用法与用量”项。

**妊娠期妇女**

1.本药可透过胎盘屏障，故妊娠期妇女及可能妊娠的妇女应慎用。

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**

本药可随乳汁排泄，故哺乳期妇女应慎用或用药时暂停哺乳。

**【不良反应】**

1.心血管系统  罕有高血压的报道。

2.呼吸系统  可见间质性肺炎(伴发热、咳嗽、呼吸困难、胸部X线异常、红细胞增多等)、肺嗜酸粒细胞浸润症(PIE综合征)。

3.肌肉骨骼系统  可见关节痛。

4.泌尿生殖系统  可见血尿素氮和肌酸酐轻度升高、蛋白尿、管型尿、阴道念珠菌病、血清尿素氮和肌酸酐暂时升高。罕见可逆性间质性肾炎、生殖器瘙痒或阴道炎(低于1%)。也有出现急性肾功能不全等严重肾损害的报道。

5.免疫系统  可见淋巴结肿胀。

6.神经系统  可见头痛。罕有活动增多、失眠、头晕、嗜睡的报道。

7.精神  罕有神经质、精神失常、幻觉的报道。

8.肝脏  可见血清丙氨酸氨基转移酶、天门冬氨酸氨基转移酶、碱性磷酸酶等一过性升高，罕见暂时性肝炎和胆汁淤积性黄疸。

9.胃肠道  可见(发生率约2.5%)食欲缺乏、恶心、呕吐、嗳气、胃部不适、腹泻、软便等，程度均较轻。也可见消化不良。还有治疗期间或治疗之后出现假膜性肠炎的报道。

10.血液  可见嗜酸粒细胞增多(2%)、短暂性淋巴细胞增多、白细胞减少。罕见血小板减少、溶血性贫血、再生障碍性贫血、粒细胞缺乏、可逆性中性粒细胞减少。

11.皮肤  可见皮疹、荨麻疹、瘙痒。罕见史-约(Stevens-Johnson)综合征、中毒性表皮坏死松解症(Lyell综合征)的报道。

12.过敏反应  可见(发生率约1.5%)过敏反应(呼吸困难、全身潮红、水肿等)、血清病样反应[典型症状包括皮肤反应(多形性红斑、皮疹)，较其他口服抗生素多见，儿童尤其常见]等。

13.其他  可见休克、发热、胸闷。长期用药可致菌群失调，引起二重感染，亦可出现维生素K、维生素B缺乏。

**【药物相互作用】**

**药物-药物相互作用**

1.丙磺舒：

结果：合用可降低本药的肾排泄率。

2.克拉维酸：

结果：合用可增强本药对某些因产生β-内酰胺酶而对本药耐药的革兰阴性杆菌的抗菌活性。

3.口服抗凝药：

结果：罕有合用使凝血酶原时间延长的报道。

4.强利尿药(如呋塞米、依他尼酸、布美他尼)、抗肿瘤药(如卡莫司汀、链佐星)、氨基糖苷类抗生素、多粘菌素类药(如多粘菌素E、多粘菌素B)、万古霉素：

结果：合用可能增加肾毒性。

5.抗酸药(如氢氧化铝或氢氧化镁)：

结果：使用以上药物后1小时内口服本药，本药的吸收程度可降低。

**药物-食物相互作用**

食物：

结果：食物不影响本药的吸收总量，但可延缓其达峰时间及降低其峰值浓度。据报道，本药与食物同时服用时，血药峰浓度仅为空腹服用时的50%-70%。

**【注意事项】**

**用药警示**

用药前须确定患者是否有对本药、其他头孢菌素、青霉素或其他药物的过敏史。

**交叉过敏**

本药与青霉素类药或头霉素有交叉过敏反应。

**不良反应的处理方法**

1.用药后应注意观察，如出现休克或呼吸困难、全身潮红、水肿等过敏反应，急性肾功能不全等严重肾损害，Stevens-Johnson综合征、Lyell综合征等，应停药并做适当处理；如发生间质性肺炎、PIE综合征，应停药并给予肾上腺皮质激素治疗。

2.治疗期间如发生轻度假膜性肠炎，通常只需停药即可奏效；对中至重度假膜性肠炎或其他二重感染，则应采取适当的治疗措施。

3.部分头孢菌素可能引起癫痫，应停药，如需要，可给予抗惊厥药。

**药物对检验值或诊断的影响**

1.直接抗球蛋白(Coombs)试验可呈阳性。

2.硫酸铜尿糖试验可呈假阳性，但葡萄糖氧化酶试验法不受影响。

3.采用Jaffe反应进行血清和尿肌酸酐值测定，可假性增高。

**【国外专科用药信息参考】**

**牙科用药信息**

1.对青霉素类过敏的患者可使用头孢菌素类抗生素。

2.牙科用药的常规剂量：用于成人颌面部感染，口服给药，一次250-500mg，每8小时1次。

**精神状况信息**

1.对精神状态的影响：用药后可能引起神经质，有引起欣快、错觉、幻觉、人格解体的报道。

2.对精神障碍治疗的影响：本药较少引起中性粒细胞减少，与氯氮平和卡马西平合用应谨慎。

**护理注意事项**

1.体质评估/监测：开始治疗前应评估患者的药物过敏史，观察是否出现肾毒性。

2.实验室检查：开始治疗前应进行细菌培养和药敏试验，监测肾功能。

**【药物过量】**

**过量的表现**

用药过量的症状可包括恶心、呕吐、上腹不适、腹泻等。

**过量的处理**

1.服用活性炭可减少药物自消化道的吸收，血液透析或腹膜透析有助于清除血清中药物。

2.对严重腹泻，需补充水分、电解质及蛋白质，不宜使用减少肠蠕动的止泻剂，但可口服万古霉素、甲硝唑、杆菌肽或考来烯胺。

**【药理】**

**药效学**

本药为第二代口服头孢菌素。其抗菌作用特点是：对革兰阴性菌产生的β-内酰胺酶比较稳定；抗革兰阴性杆菌活性和对其产生的β-内酰胺酶稳定性均比第一代头孢菌素强。

◆作用机制  与其他头孢菌素类药相似，本药主要通过与细菌细胞内的青霉素结合蛋白(PBPs)结合，抑制细菌细胞壁的生物合成而起杀菌作用。

◆抗菌谱  金黄色葡萄球菌、表皮葡萄球菌、溶血性链球菌、肺炎链球菌、流感嗜血杆菌(仅对非产β-内酰胺酶菌株)、卡他莫拉菌(包括产β-内酰胺酶菌株)、克雷伯菌属、大肠埃希菌、奇异变形杆菌、淋病奈瑟菌、伤寒沙门菌属、志贺菌属等对本药敏感。吲哚阳性变形杆菌、沙雷菌属、不动杆菌属、流感嗜血杆菌、肠球菌属和铜绿假单胞菌等对本药耐药。

**药动学**

本药口服吸收良好。空腹服用250mg或500mg，30-60分钟达血药峰浓度，分别约为7μg/ml和13μg/ml；但餐后口服500mg后的血药峰浓度仅为6.3μg/ml。

本药血浆蛋白结合率为22%-26%。药物吸收后分布于大部分器官组织及组织液中，其中在唾液和泪液中浓度较高，在中耳脓液中可达有效抗菌浓度，在脑组织中的浓度较低。药物可少量分泌入乳汁，胆汁中药物浓度低于血药浓度。

约15%的给药量可在体内代谢。服药后8小时内，60%-85%的药物以原形随尿排出，少量(约0.05%)自胆汁排泄。消除半衰期为0.6-0.9小时；轻度肾功能损害者，半衰期稍延长；严重肾功能损害者，半衰期可延长至2-3小时。血液透析能清除部分药物。

**遗传、生殖毒性与致癌性**

◆遗传毒性  尚无本药的遗传毒性的研究资料。

◆生殖毒性  小鼠、大鼠和白鼬生殖毒性试验结果表明，在给药剂量达人类推荐最大剂量的3-5倍(按体表面积计算)时，未出现明显毒性反应。对小鼠和大鼠进行多次的生殖研究，剂量高达人用量的12倍，对白鼬的研究剂量为人最大用量的3倍，本药未表现出对生育力或胎仔有损害。

◆致癌性  尚无本药的致癌性的研究资料。

**【制剂与规格】**

头孢克洛片  (1)125mg。(2)250mg。

头孢克洛分散片  (1)125mg。(2)250mg。

头孢克洛咀嚼片  125mg。

头孢克洛泡腾片  (1)125mg。(2)250mg。

头孢克洛缓释片  (1)125mg。(2)375mg。

头孢克洛胶囊  250mg。

头孢克洛缓释胶囊  (1)125mg。(2)187.5mg。

头孢克洛颗粒  (1)100mg。(2)125mg。(3)250mg。(4)500mg。

头孢克洛干混悬剂  (1)125mg。(2)750mg。(3)1.5g。

头孢克洛混悬液  (1)30ml:0.75g。(2)60ml:1.5g。

**【贮藏】**

片剂：遮光，密封，在凉暗(避光并不超过20℃)干燥处保存。

分散片：遮光，密封，在凉暗干燥处保存。

咀嚼片：密封，在凉暗干燥处保存。

泡腾片：遮光，密封，凉暗处(避光并不超过20℃)保存。

缓释片：遮光，密封，在凉暗(避光并不超过20℃)干燥处保存。

胶囊：遮光，密封，在凉暗(避光并不超过20℃)干燥处保存。

缓释胶囊：遮光，密封，在凉暗(避光并不超过20℃)干燥处保存。

颗粒：遮光，密封，在凉暗(避光并不超过20℃)干燥处保存。

干混悬剂：遮光，密封，在凉暗(避光并不超过20℃)干燥处保存。

混悬液：遮光，密闭，在阴凉处保存。

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

专题 92308 版本 1.0