**青霉素G**

文章版本号：3

最后发布时间：2014-6-16 14:23:31

**【药物名称】**

中文通用名称：青霉素G

英文通用名称：Benzylpenicillin

其他名称：苄青霉素、苄青霉素G、苄西林、海巴青霉素G、盘尼西林、配尼西林、青霉素、Benzylpenicilinum、Penicillin G。

**【药理分类】**

抗感染药>>抗生素>>青霉素类>>天然青霉素

**【临床应用】**

**CFDA说明书适应症**

1.本药为敏感菌或敏感病原体所致以下感染的首选药物：(1)溶血性链球菌感染，如咽炎、扁桃体炎、猩红热、丹毒、蜂窝织炎、产褥热等。(2)肺炎链球菌感染，如肺炎、中耳炎、脑膜炎、菌血症等。(3)不产青霉素酶的葡萄球菌感染。(4)梭状芽孢杆菌感染，如破伤风、气性坏疽等。(5)炭疽、白喉、回归热、梅毒(包括先天性梅毒)、钩端螺旋体病。(6)与氨基糖苷类药物联合用于治疗草绿色链球菌心内膜炎。

2.本药也可用于治疗流行性脑脊髓膜炎、放线菌病、淋病、奋森咽峡炎、莱姆病、鼠咬热、李斯特菌感染和除脆弱拟杆菌外的多种厌氧菌感染。

3.此外，风湿性心脏病或先天性心脏病患者进行口腔、牙科、胃肠道或泌尿生殖道手术或操作前可用本药预防感染性心内膜炎的发生。

**其他临床应用参考**

1.用于心包炎。(FDA批准适应症)

2.用于预防分娩期婴儿B族链球菌感染。

**【用法与用量】**

**成人**

◆常规剂量

·一般用法

1.静脉滴注  一日200万-2000万U，分2-4次给药。

2.肌内注射  一日80万-200万U，分3-4次给药。

◆肾功能不全时剂量

轻、中度肾功能损害患者，使用常规剂量。严重肾功能损害患者须调整剂量或延长给药间隔：(1)肌酐清除率为10-50ml/min时，给药间隔为8-12小时或剂量减少25%。(2)肌酐清除率小于10ml/min时，给药间隔为12-18小时或剂量减至正常剂量的25%-50%。

**儿童**

◆常规剂量

·一般用法

1.静脉滴注  (1)小儿：一日5万-20万U/kg，分2-4次给药。(2)新生儿(足月产)：一次5万U/kg。出生第1周患儿，每12小时1次；大于7日患儿，每8小时1次；严重感染患儿，每6小时1次。(3)早产儿：一次3万U/kg。出生第1周患儿，每12小时1次；出生2-4周患儿，每8小时1次；出生4周后患儿，每6小时1次。

2.肌内注射  (1)小儿：一次2.5万U/kg，每12小时1次。(2)新生儿(足月产)：同“静脉滴注”。(3)早产儿：同“静脉滴注”。

**【国外用法用量参考】**

**成人**

◆常规剂量

·革兰阴性菌感染所致菌血症

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日500万-2400万U，分次给药，每4-6小时1次。

·链球菌或葡萄球菌化脓性感染、心包炎、肺炎

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日500万U-2400万U，分次给药，每4-6小时1次。

2.肌内注射  青霉素G钠，一日500万-2400万U，分次给药，每4-6小时1次。

·细菌性脑膜炎

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日2400万U，分次给药，每4小时1次。

·败血症

1.静脉给药  (1)脑膜炎球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一次200万U，每2小时1次。(2)链球菌或葡萄球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日500万-2400万U，分次给药，每4-6小时1次。

·梭状芽孢杆菌感染

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日2000万U，分次给药，每4-6小时1次。

·炭疽

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日800万U，分次给药，每6小时1次。恐怖袭击吸入炭疽，一次400万U，每4小时1次，并联用多西环素或环丙沙星。

2.肌内注射  青霉素G钠，一日800万U，分次给药，每6小时1次。

·白喉

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日200万-300万U，分次给药，每4-6小时1次，疗程10-12日。

2.肌内注射  青霉素G钠，一日200万-300万U，分次给药，每4-6小时1次，疗程10-12日。

·神经梅毒

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一次300万-400万U，每4小时1次。或一日1800万-2400万U，持续静脉滴注。疗程10-14日。

·梭菌螺旋体病

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日500万-1000万U，分次给药，每4-6小时1次。

2.肌内注射  青霉素G钠，一日500万-1000万U，分次给药，每4-6小时1次。

·感染性心内膜炎

1.静脉给药  (1)自体瓣膜高度青霉素敏感链球菌感染首选疗法：青霉素G钾或青霉素G钠，一日1200万-1800万U，持续静脉给药或分4-6次给药，疗程4周。(2)自体瓣膜高度青霉素敏感链球菌感染替代疗法：青霉素G钾或青霉素G钠，一日1200万-1800万U，持续静脉给药或分6次给药，并联合使用硫酸庆大霉素一日3mg/kg，单次或分3次给药，静脉给药或肌内注射，疗程2周。(3)自体瓣膜相对青霉素耐药链球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日2400万U，持续静脉给药或分4-6次给药，并联合使用硫酸庆大霉素一日3mg/kg，单次或分3次给药，静脉给药或肌内注射，疗程2周。(4)人工瓣膜青霉素敏感链球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日2400万U，持续静脉给药或分4-6次给药，并联合或不联合硫酸庆大霉素一日3mg/kg，单次或分3次给药，静脉给药或肌内注射，疗程2周。(5)人工瓣膜相对或完全青霉素耐药链球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日2400万U，持续静脉给药或分4-6次给药，并联合使用硫酸庆大霉素一日3mg/kg，单次或分3次给药，静脉给药或肌内注射，疗程6周。(6)人工瓣膜对青霉素敏感的葡萄球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日2400万U，持续静脉给药或分4-6次给药，并联合使用利福平一次300mg，每8小时1次，静脉给药或口服，疗程至少6周，还应联合使用硫酸庆大霉素一日3mg/kg，分2-3次给药，疗程2周。(7)对青霉素、庆大霉素及万古霉素敏感的肠球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日1800万-3000万U，持续静脉给药或分6次给药，并联合使用硫酸庆大霉素一次1mg/kg，每8小时1次，连用4-6周。(8)对庆大霉素耐药的肠球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日2400万U，持续静脉给药或分6次给药。并联合使用硫酸链霉素一次7.5mg/kg，每12小时1次，静脉给药或肌内注射，疗程为4-6周。(9)链球菌或葡萄球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日500万-2400万U，分次给药，每4-6小时1次。(10)丹毒丝菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日1200万-2000万U，分次给药，每4-6小时1次，疗程4-6周。(11)李斯特菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日1500万-2000万U，分次给药，每4-6小时1次，疗程4周。(12)淋球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日1000万U，分次给药，每4-6小时1次。

2.肌内注射  (1)葡萄球菌或链球菌所致心内膜炎：青霉素G钠，推荐剂量为一日500万-2400万U，分次给药，每4-6小时1次。(2)丹毒丝菌所致心内膜炎：青霉素G钠，推荐剂量为一日1200万-2000万U，分次给药，每4-6小时1次。疗程4-6周。(3)李斯特菌所致心内膜炎：青霉素G钠，推荐剂量为一日1500万-2000万U，分次给药，每4-6小时1次。疗程4周。(4)淋球菌所致心内膜炎：青霉素G钠，推荐剂量为一日1000万U，分次给药，每4-6小时1次。

·巴斯德菌感染

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日400万-600万U，分次给药，每4-6小时1次，疗程2周。

2.肌内注射  青霉素G钠，一日400万-600万U，分次给药，每4-6小时1次，疗程2周。

·莱姆病

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日1800万-2400万U，分次给药，每4小时1次，对由脑膜炎、神经根病、第7脑神经麻痹中枢神经系统受累引起急性神经系统表现的莱姆病者，疗程为14日(范围为10-28日)；对初始住院治疗的莱姆心肌炎患者，疗程为14-21日；对莱姆关节炎伴神经系统受累(包括口服难以治疗或晚期神经系统莱姆病)，疗程为14-28日。

·放线菌感染

1.静脉给药  (1)颈面部疾病：青霉素G钾或青霉素G钠，一日100万-600万U，分次给药，每4-6小时1次。(2)胸腹部疾病：青霉素G钾或青霉素G钠，一日1000万-2000万U，分次给药，每4-6小时1次。

2.肌内注射  (1)颈面部疾病：青霉素G钠，一日100万-600万U，分次给药，每4-6小时1次。(2)胸腹部疾病：青霉素G钠，一日1000万-2000万U，分次给药，每4-6小时1次。

·鼠咬热

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日1200万-2000万U，分次给药，每4-6小时1次，疗程3-4周。

2.肌内注射  青霉素G钠，一日1200万-2000万U，分次给药，每4-6小时1次，疗程3-4周。

·预防分娩期婴儿B族链球菌感染

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，首剂给予500万U，开始分娩或羊膜破裂时给药。随后一次250万-300万U，每4小时1次，直至分娩完成。

◆肾功能不全时剂量

对肾小球滤过率(GFR)大于50ml/min者，不必减少剂量；对GFR为10-50ml/min者，在给药间隔时间不变时，减少剂量至正常的75%；对GFR小于10ml/min者，在给药间隔时间不变时，剂量减至正常的20%-50%。也有研究者建议，对肌酐清除率小于10ml/min者，一日不应超过100万-300万U，给药间隔时间为8-12小时。

◆老年人剂量

老年患者应在用药早期监测肾功能，并依据肾功能监测结果减量或延长给药间隔。

◆透析时剂量

血液透析后可给予维持剂量；对接受连续性不卧床腹膜透析的患者，推荐剂量为正常剂量的20%-50%，每6小时1次；对接受持续血液滤过者，推荐剂量为正常剂量的75%，每6小时1次。

**儿童**

◆常规剂量

·肺炎

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日15万U/kg，分次给药，每4-6小时1次。用于3个月以上婴幼儿社区获得性肺炎，一日10万-25万U/kg，分次给药，每4-6小时1次。

·细菌性脑膜炎

1.静脉给药  (1)出生7日以内者，青霉素G钾或青霉素G钠，一日15万U/kg，分次给药，每8-12小时1次。(2)出生后8-28日者，青霉素G钾或青霉素G钠，一日20万U/kg，分次给药，每6-8小时1次。(3)出生后28日以上者，青霉素G钾或青霉素G钠，一日30万U/kg，分次给药，每4-6小时1次。

·白喉

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日15万-25万U/kg，分次给药，每6小时1次，疗程7-10日。

·先天性梅毒

1.静脉给药  (1)新生儿，青霉素G钾或青霉素G钠，一次5万U/kg，出生后前7日每12小时1次，随后每8小时1次，疗程共10日。(2)1个月及1个月以上婴幼儿，青霉素G钾或青霉素G钠，一次5万U/kg，每4-6小时1次，疗程10日。

·神经梅毒

1.静脉给药  新生儿期后，青霉素G钾或青霉素G钠，一日20万-30万U/kg，分次给药，每4-6小时1次，疗程10-14日。

2.肌内注射  新生儿期后，青霉素G钠，一日20万-30万U/kg，分次给药，每4-6小时1次，疗程10-14日。

·感染性心内膜炎

1.静脉给药  (1)自体瓣膜高度青霉素敏感链球菌感染首选疗法：青霉素G钾或青霉素G钠，一日20万U/kg，分4-6次给药，疗程4周。(2)自体瓣膜高度青霉素敏感链球菌感染替代疗法：青霉素G钾或青霉素G钠，一日20万U/kg，分4-6次给药，并联合使用硫酸庆大霉素一日3mg/kg，单次或分3次给药，静脉给药或肌内注射，疗程2周。(3)自体瓣膜相对青霉素耐药链球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日30万U/kg，分4-6次给药，连用4周，并联合使用硫酸庆大霉素一日3mg/kg，单次或分3次给药，静脉给药或肌内注射，疗程2周。(4)人工瓣膜青霉素敏感链球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日30万U/kg，分4-6次给药，连用6周，并联合或不联合硫酸庆大霉素一日3mg/kg，单次或分3次给药，静脉给药或肌内注射，疗程2周。(5)人工瓣膜相对或完全青霉素耐药链球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日30万U/kg，分4-6次给药，并联合使用硫酸庆大霉素一日3mg/kg，单次或分3次给药，静脉给药或肌内注射，疗程6周。(6)人工瓣膜对青霉素敏感的葡萄球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日30万U/kg，分4-6次给药，并联合使用利福平一日20mg/kg，分3次静脉给药或口服，疗程至少6周，还应联合使用硫酸庆大霉素一次1mg/kg，每8小时1次，疗程2周。(7)对青霉素、庆大霉素及万古霉素敏感的肠球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日30万U/kg，分4-6次给药，并联合使用硫酸庆大霉素一次1mg/kg，每8小时1次，连用4-6周。(8)对庆大霉素耐药的肠球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日30万U/kg，分次给药，每4-6小时1次。并联合使用硫酸链霉素一次10-15mg/kg，每12小时1次，静脉给药或肌内注射，疗程为4-6周。(9)链球菌或葡萄球菌感染：青霉素G钾或青霉素G钠，一日15万U/kg，分次给药，每4-6小时1次。(10)淋球菌感染：①体重小于45kg者，青霉素G钾或青霉素G钠，一日25万U/kg，分次给药，每4小时1次，疗程4周。②体重为45kg及45kg以上者，青霉素G钾或青霉素G钠，一日1000万U，分4次给药。

2.肌内注射  (1)葡萄球菌或链球菌所致心内膜炎：青霉素G钠，推荐剂量为一日15万U/kg，分次给药，每4-6小时1次。(2)淋球菌所致心内膜炎：①体重小于45kg者，青霉素G钠，一日25万U/kg，分次给药，每4小时1次，疗程2周。②体重为45kg及45kg以上者，青霉素G钠，一日1000万U，分次给药，每6小时1次。

·鼠咬热

1.静脉给药  青霉素G钾或青霉素G钠，一日15万-25万U/kg，分次给药，每4小时1次，疗程4周。

2.肌内注射  青霉素G钠，一日15万-25万U/kg，分次给药，每4小时1次，疗程4周。

◆肾功能不全时剂量

对肾小球滤过率(GFR)大于50ml/min者，不必减少剂量；对GFR为10-50ml/min者，在给药间隔时间不变时，减少剂量至正常的75%；对GFR小于10ml/min者，在给药间隔时间不变时，剂量减至正常的25%-50%。也有研究者建议，对肌酐清除率小于10ml/min者，一日不应超过100万-300万U，给药间隔时间为8-12小时。

◆透析时剂量

血液透析后可给予维持剂量。

**【给药说明】**

**给药方式说明**

1.本药可经肌内或静脉给药，当成人一日剂量超过500万U时宜静脉给药。静脉给药时速度不能超过每分钟50万U，且宜分次滴入，一般每6小时1次，以避免发生中枢神经系统不良反应。

2.本药不宜鞘内给药。

**【禁忌症】**

有青霉素药物过敏史者。

**【慎用】**

1.哮喘、湿疹、花粉症、荨麻疹等过敏性疾病者。

2.肾功能损害者。

3.有癫痫发作史者(国外资料)。

**【特殊人群】**

**儿童**

儿童用药参见“用法与用量”项。

**老人**

老年患者用药参见“用法与用量”项。

**妊娠期妇女**

1.动物生殖试验未见本药导致胎仔损害。但尚未在妊娠期妇女中进行严格的对照试验，故妊娠期妇女用药应权衡利弊。

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，哺乳期妇女应用本药虽尚无发生严重问题的报道，但用药后可使乳儿出现过敏、腹泻、皮疹、念珠菌属感染等，因此，应用时须权衡利弊或暂停哺乳。

**【不良反应】**

1.代谢/内分泌系统  (1)青霉素钠100万U(0.6g)含钠离子1.7mmol(0.039g)，大剂量给药后，可造成高钠血症，并导致心力衰竭，少数患者还可出现低血钾、代谢性碱中毒等。在肾功能减退或心功能不全患者中尤易发生。(2)青霉素钾100万U(0.625g)含钾离子1.5mmol(0.066g)，如静脉大剂量给药，可发生高钾血症或钾中毒反应。

2.泌尿生殖系统  有报道大剂量使用可能引起肾衰竭与间质性肾炎。

3.神经系统  肌注区可发生周围神经炎。静脉大剂量滴注可因脑脊液药物浓度过高引起青霉素脑病(表现为肌肉阵挛、抽搐、昏迷等)。此反应多见于婴儿、老年人和肾功能不全患者。

4.精神  有报道大剂量用药后偶可引起一过性精神病发作，但发生机制尚不明确。

5.肝脏  可出现血清丙氨酸氨基转移酶、天门冬氨酸氨基转移酶升高。

6.血液  少数有凝血功能缺陷的患者，大剂量用药可干扰凝血机制，导致出血倾向。

7.过敏反应  用药后可发生严重的过敏反应，如过敏性休克(Ⅰ型变态反应)和血清病型反应(Ⅲ型变态反应)。其他过敏反应尚有溶血性贫血(Ⅱ型变态反应)、白细胞减少、药疹、接触性皮炎、哮喘发作等。

8.其他  (1)治疗期间可出现耐青霉素金黄色葡萄球菌、革兰阴性杆菌或白色念珠菌感染。念珠菌过度繁殖可使舌苔呈棕色甚至黑色。(2)治疗梅毒、钩端螺旋体病或其他感染时可由于病原体死亡致症状加剧，称赫氏反应。治疗梅毒患者时由于用药后梅毒病灶消炎过快，但组织修补相对较慢，或病灶部位纤维组织收缩，妨碍器官功能，也可能出现治疗矛盾。

**【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、保泰松和磺胺类药物：

结果：合用可升高本药的血药浓度，延长血浆半衰期；但毒性也可能增加。

机制：本药在肾小管的排泄减少。

2.华法林：

结果：合用可增强华法林的抗凝血作用。

3.甲氨蝶呤：

结果：合用可降低甲氨蝶呤的肾脏清除率，增加甲氨蝶呤毒性。

机制：相互竞争肾小管分泌。

4.抑菌药(如四环素类、红霉素、氯霉素、磺胺类药物)：

结果：合用可使本药抗菌作用降低。

机制：相互拮抗作用(以上药物可干扰本药的杀菌活性)。

处理：本药不宜与以上药物合用，尤其在治疗脑膜炎或急需杀菌剂的严重感染时。

5.考来烯胺：

结果：合用可降低本药的吸收。

机制：青霉素能与考来烯胺结合。

6.考来替泊：

结果：合用可使本药血药浓度降低78%-79%，血药浓度-时间曲线下面积(AUC)减少75%-85%。

7.避孕药：

结果：合用可降低避孕药的药效。

机制：避孕药的肠肝循环减少。

**【注意事项】**

**用药警示**

用药前须详细询问患者既往史，包括用药史、过敏反应史以及有无家族变态反应疾病史。

**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过敏，也可能对青霉胺或头孢菌素类药过敏。

**皮肤过敏试验**

用药前必须先做本药皮肤敏感试验。皮试液浓度为500U/ml，皮内注射0.05-0.1ml，20分钟后观察皮试结果，阳性反应者不能应用本药。青霉素皮试对预测过敏性休克起着重要作用，但皮试阴性者不能排除出现过敏反应的可能。

**不良反应的处理方法**

用药中，一旦发生过敏反应，应立即肌注0.1%肾上腺素0.5-1ml，必要时以5%葡萄糖注射液或氯化钠注射液稀释后静脉注射。临床表现无改善者，半小时后重复1次；心跳停止者，可给予肾上腺素心内注射。同时静脉滴注肾上腺皮质激素，并补充血容量。血压持久不升者可给以多巴胺等血管活性药。同时可考虑采用抗组胺药，以减轻荨麻疹。有呼吸困难者应予以氧气吸入或人工呼吸；喉头水肿明显者，应及时进行气管插管或气管切开。

**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。

**用药前后及用药时应当检查或监测**

大剂量使用本药时应定期检测电解质。

**其他注意事项**

本药极易溶于水，水溶液中β-内酰胺环易裂解，水解率随温度升高而加速，裂解为无活性产物青霉酸和青霉素噻唑酸，后两者可降低pH，使青霉素水解进一步加强。20U/ml的本药溶液于30℃放置24小时，效价下降56%。因此注射液应新鲜配制应用，配制后不宜久置。

**【国外专科用药信息参考】**

**精神状况信息**

对精神状态的影响：用药后较少引起嗜睡或意识模糊。

**护理注意事项**

1.开始治疗前应评估患者细菌培养和药敏试验结果及有无药物过敏史。

2.应避免静脉注射或动脉注射，并避免将药物注射入周围主要神经和血管。

3.监测患者有无过敏反应、机会性感染(如发热、寒战、溃疡不愈合、口腔或阴道白斑、脓性分泌物、疲劳)、中枢神经系统改变及血栓性静脉炎。

4.实验室检查：长期用药或大剂量使用本药时应定期监测电解质、肝功能、肾功能、心脏功能和血液系统功能。

**【药物过量】**

**过量的表现**

药物过量的主要表现是中枢神经系统不良反应。

**过量的处理**

药物过量时应及时停药并予对症、支持治疗，必要时可采用血液透析加速药物排泄。

**【药理】**

**药效学**

本药是一种繁殖期杀菌药。

◆作用机制  本药通过干扰细菌细胞壁的合成而产生抗菌作用。研究结果提示青霉素结合蛋白(PBPs)是青霉素等β-内酰胺类抗生素的作用靶位。由于青霉素等与PBPs的紧密结合，使前者对细菌细胞壁合成的早期阶段发生抑制作用。

PBPs为存在于细菌细胞膜上的蛋白，其数目、分子大小和青霉素等抗生素的结合量因细菌菌种不同而异。PBPs具有催化粘肽代谢酶的功能，如转肽酶反应；也有研究发现PBPs是参与细胞壁生物合成的对青霉素敏感的酶，如转肽酶、羧肽酶、内肽酶等。PBP-1B和PBP-1A为使细菌延长的最重要蛋白，经青霉素等作用后可使细菌迅速溶解；PBP-2与控制细菌形态有关，受青霉素作用后，细菌可形成渗透压稳定的球形体；PBP-3对细菌细胞中隔形成和细菌分裂有重要作用，PBP-4、PBP-5、PBP-6则重要性较差。

◆抗菌谱  革兰阳性球菌：溶血性链球菌(A、B、C、G、F组)、不产青霉素酶的葡萄球菌、敏感的肺炎链球菌和厌氧的阳性球菌(如消化球菌、消化链球菌)。

革兰阳性杆菌：白喉棒状杆菌、炭疽芽孢杆菌、单核细胞增多性李斯特菌、厌氧的破伤风梭状芽孢杆菌、产气荚膜梭状芽孢杆菌、败血梭状芽孢杆菌、肉毒梭状芽孢杆菌(肉毒杆菌)、放线菌属、真杆菌属、丙酸杆菌。

革兰阴性球菌：脑膜炎奈瑟菌、淋病奈瑟菌、卡他莫拉菌。

螺旋体：梅毒螺旋体、钩端螺旋体、包柔氏螺旋体、鼠咬热螺旋体等。

肠杆菌属、铜绿假单胞菌、布鲁杆菌等革兰阴性杆菌对本药耐药。

**药动学**

本药口服吸收差，但肌注或静脉给药后吸收良好。肌注100万U(600mg)，0.5小时后可达血药峰浓度，约为12μg/ml。对多数敏感菌的有效血药浓度可维持5小时。新生儿肌注2.5万U/kg(15mg/kg)，0.5-1小时后平均血药峰浓度约为22μg/ml。5分钟内静脉注射500万U(3g)，5分钟和10分钟后的平均血药浓度分别为400μg/ml、273μg/ml；1小时即降至45μg/ml，4小时后降至3μg/ml。6小时内静脉滴注相同剂量药物，2小时后可获得12-20μg/ml的血药浓度。

本药血浆蛋白结合率为45%-65%。药物吸收后可广泛分布于各组织、体液中。在胸、腹腔和关节腔液中浓度约为血药浓度的50%；在乳汁中浓度为血药浓度的5%-20%。易透入有炎症的组织，也可透过胎盘，除在妊娠早期羊水中药物浓度较低外，一般在胎儿和羊水中均可获得有效治疗浓度。本药还可进入红细胞，如作静脉注射，继以恒速静脉滴注，2小时后红细胞中药物浓度与血药浓度相等或超过后者。本药不易透入眼、骨组织、无血供区域和脓肿腔中，也难以透过血-脑脊液屏障。在无炎症脑脊液中的浓度仅为血药浓度的1%-3%，在有炎症的脑脊液中浓度可达血药浓度的5%-30%。

约19%的药物在肝内代谢。肾功能正常情况下，约75%的给药量于6小时内经肾脏排出。健康成年人主要通过肾小管排泄药物，经肾小球排泄者仅占10%左右；新生儿则主要经肾小球排泄。肌内注射50万U(300mg)后，平均19%的给药量经尿液以青霉噻唑酸排出。另有少量药物经胆汁排泄，粪便中药物含量较少(药物在下消化道中可被产青霉素酶的肠道菌所破坏)。本药半衰期约为30分钟，肾功能减退者半衰期可延长至2.5-10小时；老年人和新生儿半衰期也较长，且新生儿的半衰期与体重、年龄有关。血液透析可有效清除本药，但腹膜透析无此作用。

**【制剂与规格】**

注射用青霉素钠(每1mg青霉素钠相当于1670个青霉素单位)  (1)0.12g(20万U)。(2)0.24g(40万U)。(3)0.48g(80万U)。(4)0.6g(100万U)。(5)0.96g(160万U)。(6)2.4g(400万U)。(7)3.84g(640万U)。(8)4.8g(800万U)。

注射用青霉素钾(每1mg青霉素钾相当于1598个青霉素单位)  (1)0.125g(20万U)。(2)0.25g(40万U)。(3)0.5g(80万U)。(4)0.625g(100万U)。

**【贮藏】**

粉针剂：遮光，凉暗(不超过20℃)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 92335 版本 1.0