



(3) 皮肤反应：皮疹、瘙痒。

(4) 其他反应：如厌食、阴道炎、口腔炎、头晕或呼吸困难等。

2. 本品也可引起下列反应：

(1) 消化系统：消化不良、胃肠胀气、粘膜炎症、口腔念珠菌病、胃炎等。

(2) 神经系统：头痛、嗜睡等。

(3) 过敏反应：支气管痉挛等。

(4) 其他反应：味觉异常等。

(5) 实验室检查：血清氨基转移酶、肌酐、乳酸脱氢酶、胆红素及碱性磷酸酶升高，白细胞、中性粒细胞及血小板计数减少。

**【禁忌】**对阿奇霉素、红霉素或其他任何一种大环内酯类药物过敏者禁用。

**【注意事项】**

1. 轻度肾功能不全患者(肌酐清除率 $>40\text{ml/分钟}$ )不需作剂量调整，但阿奇霉素对较严重肾功能不全患者中的使用尚无资料，给这些患者使用阿奇霉素时应慎重。

2. 由于肝胆系统是阿奇霉素排泄的主要途径，肝功能不全者慎用，严重肝病患者不应使用。用药期间定期随访肝功能。

3. 用药期间如果发生过敏反应(如血管神经性水肿、皮肤反应、Stevens-Johnson 综合征及毒性表皮坏死等)，应立即停药，并采取适当措施。

4. 治疗期间，若患者出现腹泻症状，应考虑假膜性肠炎发生。如果诊断确立，应采取相应治疗措施，包括维持水、电解质平衡、补充蛋白质等。

5. 治疗盆腔炎时若怀疑合并厌氧菌感染，应合用抗厌氧菌药物。

6. 使用本品期间，如出现任何不良事件和/或不良反应，请咨询医生。

7. 同时使用其他药品，请告知医生。

8. 请放置于儿童不能够触及的地方。

**【孕妇及哺乳期妇女用药】**

动物实验显示本品对胎儿无影响，但在人类孕妇中应用尚缺乏经验，故在孕妇中应用须充分权衡利弊。尚无资料显示本品是否可分泌至母乳中，故哺乳期妇女应用须谨慎考虑。

**【儿童用药】** 16岁以下患者使用本品的安全性尚不清楚。

**【老年用药】** 未见老年用药相关报道。老年、体弱患者慎用。

**【药物相互作用】**

1. 与茶碱合用时能提高后者在血浆中的浓度，应注意检测血浆茶碱水平。

2. 与华法林合用时应注意检查凝血酶原时间。

3. 与下列药物同时使用时，建议密切观察患者：

地高辛——使地高辛水平升高。

麦角胺或二氢麦角胺——急性麦角毒性，症状是严重的末梢血管痉挛和感觉迟钝(触物感痛)。

三唑仑——通过减少三唑仑的降解，而使三唑仑的药理作用增强。

细胞色素 P450 系统代谢药——提高血清中卡马西平、特非那定、环孢素、环己巴比妥、苯妥英的水平。

4. 与利福布汀合用会增加后者的毒性。

**【药物过量】** 药物过量的不良反应与推荐剂量的相同。一旦发现超量使用，可根据病情给予对症和支持治疗。

**【药理毒理】**

药理作用

阿奇霉素为氮杂内酯类抗生素，其作用机理是通过与敏感微生物的 50s 核糖体的亚单位结合，从而干扰其蛋白质的合成(不影响核酸的合成)。

体外试验和临床研究均表明，阿奇霉素对以下多种致病菌有效：

**革兰阳性需氧微生物：**金黄色葡萄球菌、酿脓链球菌、肺炎链球菌、溶血性链球菌。

阿奇霉素对于耐红霉素的革兰阳性菌有交叉耐药性。大多数粪链球菌(肠球菌)以及耐甲氧西林的葡萄球菌对阿奇霉素耐药。

**革兰阴性需氧微生物：**流感嗜血杆菌、卡他摩拉菌

其他微生物：沙眼支原体。

体外试验和临床研究已证实，阿奇霉素可预防和治疗鸟胞内分支杆菌复合体（由鸟胞内分支杆菌和胞内分支杆菌组成）引起的疾病。

细菌产生的 $\beta$ -内酰胺酶不影响阿奇霉素的活性。

对以下微生物已有体外研究结果，但是其临床意义尚不清楚，包括链球菌属（C、F、G）草绿色链球菌、百日咳杆菌、空肠弯曲杆菌、杜克嗜血杆菌、嗜肺性军团菌、双路普雷沃氏菌、产气荚膜梭菌、消化链球菌属、包柔螺旋体、肺炎支原体、梅毒螺旋体、解脲脲原体等。

毒理研究

遗传毒性：

人淋巴细胞试验、小鼠骨髓微核试验和小鼠体外淋巴瘤细胞试验的结果阿奇霉素未表现出致突变作用。

生殖毒性：

大鼠和小鼠的生殖毒性试验均表明，当阿奇霉素（经口给药）剂量达产生中等程度的母体毒性的剂量水平（即200mg/kg/日，按体表面积计算，约为人用药剂量500mg/kg/日的2-4倍）时，未发现致畸胎作用。

尚未发现对生育力和胎儿的损害。目前尚无在妊娠妇女中进行充分的和严格对照的临床试验。由于动物生殖研究的结果并不总是能预测人的情况，因此，只有在确实必要时，孕妇才能使用本品。尚不知本品是否在人乳汁中分泌，由于许多药物经人乳汁分泌，因此哺乳期的妇女在使用时应注意。

致癌性：尚无有关本品动物长期用药的致癌性研究资料。

#### 【药代动力学】

据文献资料：

社区获得性肺炎患者静脉滴注阿奇霉素，每日一次，每次0.5g，浓度为2mg/ml，每次滴注时间1小时，连续2~5日，平均血浆峰浓度（ $C_{max}$ ）为 $3.63 \pm 1.60 \mu\text{g/ml}$ ，平均血浆谷浓度（ $C_{min}$ ）为 $0.20 \pm 0.15 \mu\text{g/ml}$ ， $AUC_{0-24}$ 为 $9.60 \pm 4.80 \mu\text{g} \cdot \text{h/ml}$ 。

在正常志愿者，静脉滴注阿奇霉素，每日一次，每次0.5g，浓度为1mg/ml，滴注时间为3小时，连续2~5日，平均血浆峰浓度（ $C_{max}$ ）为 $1.14 \pm 0.13 \mu\text{g/ml}$ ，平均血浆谷浓度（ $C_{min}$ ）为 $0.18 \pm 0.02 \mu\text{g/ml}$ ， $AUC_{0-24}$ 为 $8.03 \pm 0.86 \mu\text{g} \cdot \text{h/ml}$ 。该用法用量条件下，社区获得性肺炎病人的药代动力学参数与正常志愿者基本一致。

单次静脉滴注阿奇霉素1g、4g，滴注时间大于2小时，其清除率（ $CL_t$ ）和表观分布体积（ $V_d$ ）分别为10.18（ml/min）/kg和33.3L/kg。阿奇霉素在体内分布广泛，在各组织内浓度可达同期血浓度的10~100倍，在巨噬细胞及纤维母细胞内浓度高，前者能将阿奇霉素转运至炎症部位。每日静滴阿奇霉素0.5g，连续5日，第1次给药后的24小时内约11%的给药量以原形从尿液中排出，第5次给药后排到尿液中的阿奇霉素约为14%。此外，阿奇霉素可经胆道以原形（胆汁内可见高浓度的阿奇霉素）及10种代谢物排出。阿奇霉素的血清蛋白结合率随血药浓度的增加而减低，当血药浓度为 $0.02 \mu\text{g/ml}$ 时，血清蛋白结合率为15%；当血药浓度为 $2 \mu\text{g/ml}$ 时，血清蛋白结合率为7%。阿奇霉素单剂给药后的血消除半衰期（ $t_{1/2\beta}$ ）为35~48小时。

【贮藏】密闭，在阴凉（不超过20℃）干燥处保存。

【包装】管制抗生素玻璃瓶装，10瓶/盒。

【有效期】24个月。

【执行标准】新药转正标准WS1-(X-296)-2003Z

【批准文号】（1）国药准字H20066439：0.125g（2）国药准字H20066440：0.25g（3）国药准字H20066441：0.5g

【生产单位】

企业名称：北京星昊医药股份有限公司

生产地址：北京市经济技术开发区中和街18号

邮政编码：100176

电话号码：010-67888388

传真号码：010-67875630

网 址：www.sunho.com.cn