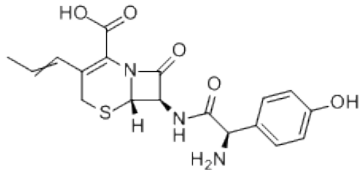


本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[92665-29-7](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)如果您觉得本站对您的学习工作有帮助, 请与您的朋友一起分享:) [爱化学www.icchemistry.cn](#)

CAS Number:92665-29-7 基本信息

中文名:	头孢丙烯; (6R,7R)-7-[(2R)-2-氨基-2-(4-羟基苯基)乙酰氨基]-8-氧代-3-(1-丙烯基)-5-硫杂-1-氮杂双环[4.2.0]
英文名:	Cefprozil
别名:	8-[2-Amino-2-(4-hydroxyphenyl)-acetyl]amino-7-oxo-4-prop-1-enyl-2-thia-6-azabicyclo[4.2.0]oct-4-ene-5-carboxylic acid; (6R-(6alpha,7beta(R*)))-7-((Amino(4-hydroxyphenyl)acetyl)amino)-8-oxo-3-(1-propen
分子结构:	
分子式:	C ₁₈ H ₁₉ N ₃ O ₅ S
分子量:	389.43
CAS登录号:	92665-29-7

CAS#92665-29-7化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

供应商信息已更新, 请登录爱化学 [CAS No. 92665-29-7 查看](#)若您在此化学品供应商, 请按照[化工产品收录](#)说明进行免费添加

其他信息

产品应用: **头孢丙烯** (92665-29-7) 为第二代头孢菌素类抗生素, 具广谱抗菌作用用于敏感菌所引起的轻度到中度皮肤感染和呼吸道感染。对化脓性肺炎和无乳链球菌、对甲氧西林敏感的金葡萄菌作用强, 对流感嗜血菌等也有抑制作用。

头孢丙烯 (92665-29-7) 的制备方法:

- 7-氨基-3-氯甲基-3-头孢-4-羧酸二苯甲酯和D-α-(N-叔丁氧羰基氨基)-α-(4-羟基苯基) 乙酸溶于四氢呋喃, 在5~10℃和搅拌下, 加入N,N'-二环己基碳化二亚胺。在室温下搅拌1.5h后, 浓缩。
- 浓缩液用乙酸乙酯稀释后, 过滤除去形成的二环己基脲沉淀。滤液依次用碳酸氢钠水溶液、水和饱和氯化钠水溶液洗, 干燥。浓缩, 剩余物溶于丙酮, 加入碘化钠, 在室温下搅拌30min后, 浓缩至干。剩余物溶于乙酸乙酯, 依次用硫代硫酸钠水溶液、水和氯化钠水溶液洗, 干燥。浓缩后, 冷至5℃, 在搅拌下加入三苯基膦, 再在室温下搅拌16h。过滤收集沉淀, 用冷乙酸乙酯和乙醚洗, 真空干燥。得膦化物。该膦化物溶于氯仿, 加入水和1mol/L氢氧化钠的溶液, 摇晃5min。分出有机层, 用水和氯化钠水溶液洗, 干燥。过滤, 滤液浓缩。在搅拌下加入90%乙醚, 室温搅拌30min后, 用无水硫酸镁干燥。过滤, 滤液用硅胶柱层析, 氯仿和氯仿-甲醇(99:1)洗脱。收集含产物的组分, 浓缩至干, 得烯化产物。
- 将该产物和三氟乙酸在室温下搅拌30min后, 用乙醚和异丙醚稀释。过滤收集沉淀, 用乙醚洗后, 溶于甲醇。加入1mol/L 2-乙基己酸钠的乙酸乙酯溶液, 形成沉淀。过滤收集该沉淀; 用乙酸乙酯和乙醚洗, 真空干燥得头孢罗齐。规格: 按无水物计算, 每1mg含不少于900μg和不大于1050μg的头孢丙烯 (C₁₈H₁₉N₃O₅S); pH值应在3.5~6.5 (每mL含5mg的头孢丙烯); 含水分应不少于3.5%和不大于6.5%; E异构体的比例应为: E/(E+Z)=0.06~0.11。

头孢丙烯 (92665-29-7) 药理毒理: 本品为第二代头孢菌素类抗生素, 具广谱抗菌作用。体外试验证明, 本品对革兰阳性需氧菌中的金黄色葡萄球菌(包括产β内酰胺酶菌株)、肺炎链球菌、化脓性链球菌的作用明显, 对坚韧链球菌、单核细胞增多性李斯特菌、表皮葡萄球菌、腐生葡萄球菌、Warnei葡萄球菌、无乳链球菌、溶血性链球菌和草绿色链球菌具抑制作用。对耐甲氧西林葡萄球菌和粪肠球菌无效。对革兰阴性需氧菌的流感嗜血杆菌(包括产β-内酰胺酶菌株)、卡他莫拉菌(包括产β内酰胺酶菌株)高度敏感; 可抑制Diversus枸橼酸菌、大肠杆菌、肺炎克雷伯菌、淋病

奈瑟菌(包括产 β -内酰胺酶菌株)、奇异变形杆菌、沙门菌属、志贺菌和弧菌的繁殖;对不动杆菌属、肠杆菌属、普通变形杆菌、普罗威登菌属、假单胞菌属的多数菌株无抗菌作用。本品对厌氧菌中的黑色素类杆菌、艰难梭杆菌、产气荚膜杆菌、梭杆菌属、消化链球菌和痤疮丙酸杆菌具一定抑制作用,对多数脆弱杆菌株无抗菌作用。本品的作用机制是抑制细菌细胞壁的合成,使细菌迅速破裂溶解。

头孢丙烯(92665-29-7)药代动力学:国内试验已经证明空腹口服头孢丙烯片剂和混悬剂具生物等效。据文献报道,受试者空腹口服本品,给药量的约95%可被吸收。健康者的平均血消除半衰期($t_{1/2}$)约1.3小时,稳态分布容积(Vd)约0.23L/kg。总清除率和肾清除率分别为3ml/min/kg和2.3ml/min/kg左右。受试者空腹口服本品250mg、500mg、1g后约1.5小时达血药峰浓度(C_{max}),平均血峰浓度分别为6.1 mg/L、10.5 mg/L和18.3mg/L。尿回收率约为服药量的60%。口服本品250mg、500mg和1g后最初4小时,尿中平均浓度分别为700 mg/L、1000 mg/L和2900 mg/L。与食物同服不影响本品的药-时曲线下面积(AUC)和血药峰浓度,但达峰时间可延长0.25小时~0.75小时。血浆蛋白结合率约为36%,当血药浓度在2~20 mg/L范围内时,血浆蛋白结合率与血药浓度的变化无关。肾功能正常者口服本品一次1000mg,每8小时1次,连续10天,未见有药物血浆蓄积现象。对于肾功能减退患者,根据肾功能损害程度的不同,本品的血消除半衰期($t_{1/2}$)可延长至5.2小时;肾功能完全丧失患者,血消除半衰期可达5.9小时。血液透析时,半衰期缩短。肝功能损害患者本品的血消除半衰期可延长至2小时左右,但这种改变并不说明肝功能损伤患者需调整剂量。在老年人(≥ 65 岁),本品的平均药-时曲线下面积(AUC)相对于年轻成人约增高35%~60%,女性AUC较男性AUC高15%~20%。哺乳期妇女一次口服本品1g,可在乳汁中测得少量药物(<给药量的0.3%)。24小时平均浓度为0.25mg/L~3.3mg/L。

头孢丙烯(92665-29-7)适应症:用于敏感菌所致的下列轻、中度感染:

1. 上呼吸道感染

(1) 化脓性链球菌性咽炎/扁桃体炎。

注:通常治疗和预防链球菌感染(包括预防风湿热)应选择肌肉内注射青霉素。虽然头孢丙烯一般可有效清除鼻咽部的化脓性链球菌,但目前尚无可供借鉴的头孢丙烯预防继发性风湿热的资料。

(2) 肺炎链球菌、嗜血流感菌(包括产B-内酰胺酶菌株)和卡他莫拉菌(包括产B-内酰胺酶菌株)性中耳炎和急性鼻窦炎。

2. 下呼吸道感染

由肺炎链球菌、嗜血流感杆菌(包括产B-内酰胺酶菌株)和卡他莫拉菌(包括产B-内酰胺酶菌株)引起的急性支气管炎继发细菌感染和慢性支气管炎急性发作。

3. 皮肤和皮肤软组织

金黄色葡萄球菌(包括产青霉素菌株)和化脓性链球菌引起的非复杂性皮肤和皮肤软组织感染,但脓肿通常需行外科引流排脓。

适当时应进行细菌培养和药敏试验以确定病原菌对头孢丙烯的敏感性。

头孢丙烯(92665-29-7)用法用量:

生产方法及其他:

口服,成人(13岁或以上)上呼吸道感染:一次0.5g,一日1次;下呼吸道感染,一次0.5g,一日2次;皮肤或皮肤软组织感染,一日0.5g,分1次或2次服用,严重病例一次0.5g,一日2次。

2至12岁儿童上呼吸道感染:按体重一次7.5mg/kg,一日2次;皮肤或皮肤软组织感染:按体重一次20mg/kg,一日1次。

6个月婴儿至12岁儿童中耳炎:按体重一次15mg/kg,一日2次;急性鼻窦炎:一般按体重一次7.5mg/kg,一日2次;严重病例,按体重一次15mg/kg,一日2次。

疗程一般7~14日,但B溶血性链球菌所致急性扁桃体炎,咽炎的疗程至少10天。

头孢丙烯(92665-29-7)孕妇及哺乳期妇女用药:

1. 孕妇慎用。

2. 哺乳期妇女一次口服本品1g,可在乳汁中测得少量药物(<服用量的0.3%)。24小时平均浓度为0.25mg/L~

3.3mg/L。由于尚不明确本品对婴儿的影响,故哺乳期妇女服用本品应谨慎或暂停哺乳。

儿童用药:尚无6个月以下小儿患者使用本品的安全性和疗效的资料。然而,已有有关其他头孢菌素类药物在新生儿体内蓄积(由于此年龄段小儿的药物半衰期延长)的报道。

老年患者用药:在老年人(≥ 65 岁),本品的平均药-时曲线下面积(AUC)相对于年轻成人增高35%~60%。老年患者宜在医师指导下根据肾功能情况调整用药剂量或用药间期。

头孢丙烯(92665-29-7)药物相互作用:

1. 呋塞米、依他尼酸、布美他尼等强利尿药,卡氮芥、链佐星等抗肿瘤药及氨基糖苷类抗生素等肾毒性药物与本品合用有增加肾毒性的可能。

2. 克拉维酸可增强本品对某些因产生β-内酰胺酶而对本品耐药的革兰阴性杆菌的抗菌活性。

3. 本品与丙磺舒合用可使本品的药-时曲线下面积值(AUC值)增加一倍。

药物过量: 本品主要经肾脏清除, 对严重过量, 尤其是肾功能损伤患者, 血液透析有助于清除本品。

规格: 31.5g: 1.5g 商品名“旋复捷”片剂: 250mg/片, 500mg/片。用量: 成人每日0.5-1g, 分1-2次口服。

头孢丙烯(92665-29-7)的不良反应:

1. 头孢丙烯的不良发应与其他口服头孢菌素相似, 主要为胃肠道反应, 包括腹泻, 恶心, 呕吐和腹痛等。亦可发生过敏反应, 常见为皮疹, 荨麻疹。儿童发生过敏反应较成人多见, 多在开始治疗后几天内出现, 停药后几天内消失。其他不良反应较少, 包括:

肝胆系统: AST(谷草转氨酶)和ALT(谷丙转氨酶)升高。偶见碱性磷酸酶和胆红素升高。胆汁淤积性黄疸罕见。

中枢神经系统: 眩晕, 多动, 头痛, 精神紧张, 失眠。偶见嗜睡。所有这些反应均呈可逆性。

血液系统: 白细胞减少, 嗜酸粒细胞增多。

肾脏: 血清尿素氮增高, 血清肌酐增高。

其他: 尿布皮炎样皮疹和二重感染, 生殖器瘙痒和阴道炎。

下述不良事件, 无论是否已明确其与头孢丙烯的因果关系, 在上市后监测中均少见。包括过敏, 血管神经性水肿, 结肠炎(包括伪膜性结肠炎), 多形性红斑, 发热, 血清病样反应, Stevens-Johnson综合征和血小板减少症。

2. 头孢菌素类药物的不良反应

除上述所列使用丙烯发生的不良反应外, 头孢菌素类药物尚有以下的不利反应和引起实验室检查异常: 再生障碍性贫血, 溶血性贫血, 出血, 肾功能不全, 中毒性表皮坏死, 中毒性肾病, 凝血酶原时间延长, Coomb试验阳性, LDH增高, 全血细胞减少, 中性粒细胞减少, 粒细胞缺乏症。

有几种头孢菌素类药物与癫痫发作有关, 特别是肾功能损伤患者未减少用量时(见用法用量)。如与药物治疗有关的癫痫发作, 应停用药物, 并根据临床表现进行抗惊厥治疗。

禁忌症: 对本品及其他头孢菌素类过敏者禁用。

注意事项: 使用本品治疗前, 应仔细询问病人是否有头孢丙烯和其他头孢菌素类药物, 青霉素类及其他药物的过敏史。有青霉素过敏史患者服用本品应谨慎。凡以往有青霉素类药物所致过敏性休克史或其他严重过敏反应者不宜使用本品。

如发生过敏反应, 应停止用药。严重过敏反应需使用肾上腺素并采取其他紧急措施, 包括给氧、静脉输液, 静注抗组胺药、皮质激素、升压药及人工呼吸。

几乎所有抗菌药物包括头孢丙烯长期使用可引起非敏感性微生物的过度生长, 改变肠道正常菌群, 诱发二重感染, 尤其是伪膜性结肠炎。因此应仔细观察用药病人服药后的反应, 特别注意对继发腹泻患者的诊断。如在治疗期间发生二重感染, 应采取适当的措施。对伪膜性肠炎患者, 轻度病例仅需停用药物, 而中至重度病例, 根据临床症状采取调节水和电解质平衡, 补充蛋白, 和用对耐药菌有效的抗菌药物治疗。

确诊或疑有肾功能损伤的病人(见用法用量)在用本品治疗前和治疗时, 应严密观察临床症状并进行适当的实验室检查。在这些病人中, 常规剂量时血药浓度较高或/和排泄减慢, 故因减少本品的每日用量。同时服用强利尿剂治疗的病人使用头孢菌素应谨慎, 因为这些药物可能会对肾功能产生有害影响。

患有胃肠道疾病, 尤其是肠炎病人应慎用头孢丙烯。

相关化学品信息

[92116-66-0](#) [92089-94-6](#) [92075-69-9](#) [92088-04-5](#) [92880-05-2](#) [925427-08-3](#) [92736-22-6](#) [92287-40-6](#) [C.I. 活性蓝236](#) [92400-09-4](#) [反式-2-己烯-1-醇](#) [4-对叔丁基杯\[8\]芳烃八醋酸八乙酯](#) [92838-13-6](#) [92446-24-7](#) [92397-22-3](#) 444