

核准日期：2007年02月20日

修改日期：2007年08月02日

修改日期：2008年05月23日

修改日期：2008年07月07日

修改日期：2009年01月21日

修改日期：2009年10月30日

注射用亚胺培南西司他丁钠说明书

请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

[药品名称]

通用名称：注射用亚胺培南西司他丁钠

商品名称：泰能[®] (TIENAM[®])

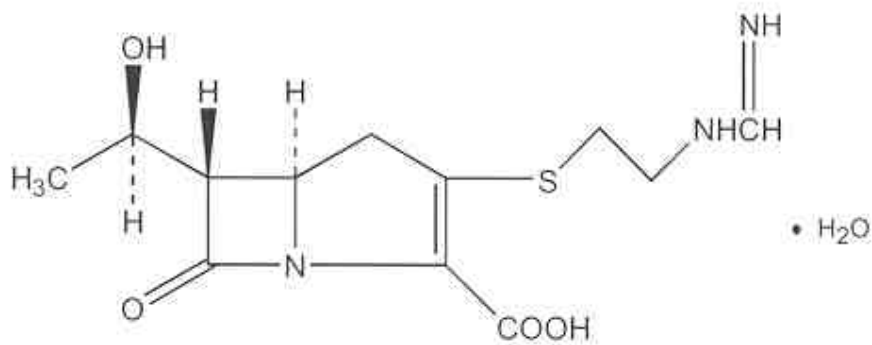
英文名称：Imipenem and Cilastatin Sodium for Injection

汉语拼音：Zhusheyong Yaanpeinan Xisitadingna

[成份]

本品为复方制剂，其组份为亚胺培南 500mg 和西司他丁钠(以 $C_{16}H_{26}N_2O_5S$ 计) 500mg。辅料为碳酸氢钠。

亚胺培南的化学结构式：

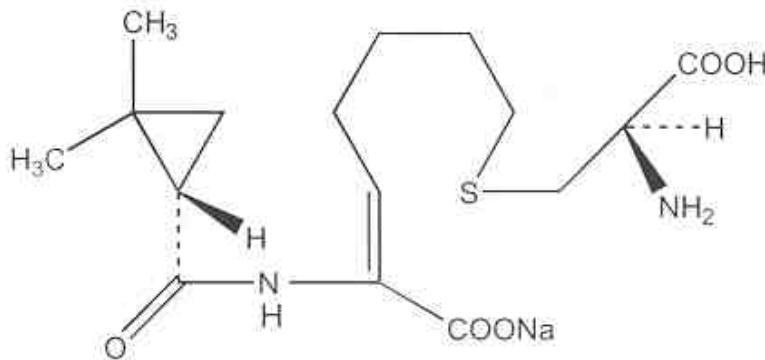


Imipenem

分子式：C₁₂H₁₇N₃O₄S·H₂O

分子量：317.4

西司他丁钠的化学结构式：



分子式：C₁₆H₂₅N₂O₅SNa

分子量：380.4

[性状]

本品为白色至类白色粉末。

[适应症]

治疗

本品（注射用亚胺培南西司他丁钠）为一非常广谱的抗生素，特别适用于多种病原体所致和需氧/厌氧菌引起的混合感染，以及在病原菌未确定前的早期治疗。本品适用于由敏感细菌所引起的下列感染：

- 腹腔内感染
- 下呼吸道感染
- 妇科感染
- 败血症
- 泌尿生殖道感染
- 骨关节感染
- 皮肤软组织感染

● 心内膜炎

本品适用于治疗由敏感的需氧菌/厌氧菌株所引起的混合感染。这些混合感染主要与粪便、阴道、皮肤及口腔的菌株污染有关。脆弱拟杆菌是这些混合感染中最常见的厌氧菌，它们通常对氨基糖甙类、头孢菌素类和青霉素类抗生素耐药，而对本品敏感。

已经证明**本品**对许多耐头孢菌素类的细菌，包括需氧和厌氧的革兰氏阳性及革兰氏阴性细菌所引起的感染仍具有强效的抗菌活性；这些细菌耐药的头孢菌素类抗生素包括头孢唑啉、头孢哌酮、头孢噻吩、头孢西丁、头孢噻肟、羧苄氧酰胺菌素、头孢孟多、头孢他啶和头孢曲松。同样，许多由耐氨基糖甙类抗生素（如庆大霉素、阿米卡星、妥布霉素）和/或青霉素类（氨苄西林、羧苄西林、青霉素、替卡西林、哌拉西林、阿洛西林、美洛西林）的细菌引起的感染，使用**本品**仍有效。

本品不适用于脑膜炎的治疗。

预防

对那些已经污染或具有潜在污染性外科手术的病人或术后感染一旦发生将会特别严重的操作，**本品**适用于预防这样的术后感染。

[规格]

亚胺培南 500mg 和 西司他丁 500mg

[用法用量]

本品以静脉滴注剂型供应。

本品的推荐剂量是以亚胺培南的使用量表示，也表示同等剂量的西司他丁。

本品的每天总剂量根据感染的类型和严重程度而定；并按照病原菌的敏感性、患者的肾功能和体重，考虑将一天的总剂量等量分次给予患者。

治疗：肾功能正常的成年病人的剂量安排

表(一)列出的剂量是根据病人的肾功能正常(肌酐清除率 $>70\text{ml}/\text{min}(\text{分})/1.73\text{m}^2$)和体重 ≥ 70 千克而定的。肌酐清除率 $\leq 70\text{ml}/\text{min}(\text{分})/1.73\text{m}^2$ (见表(二))和/或体重 < 70 千克的病人必须减少剂量。对体重很轻和/或中度至严重肾功能不全的

病人来说，减低**本品**剂量尤为重要。

对大多数感染的推荐治疗剂量为每天 1–2 克，分 3–4 次滴注。对中度感染也可用每次 1 克，每天 2 次的方案。对不敏感病原菌引起的感染，**本品**静脉滴注的剂量最多可以增至每天 4 克，或每天 50 毫克/千克体重，两者中择较低剂量使用。

当每次**本品**静脉滴注的剂量低于或等于 500 毫克时，静脉滴注时间应不少于 20–30 分钟，如剂量大于 500 毫克时，静脉滴注时间应不少于 40–60 分钟。如病人在滴注时出现恶心症状，可减慢滴注速度。

表（一）肾功能正常和体重≥70 公斤*的成年病人使用本品静脉滴注的剂量安排

感染程度	剂量 (亚胺培南毫克)	给药间隔时间	每日总剂量
轻度†	250 毫克	6 小时	1.0 克
中度	500 毫克	8 小时	1.5 克
	1000 毫克	12 小时	2.0 克
严重的敏感细菌感染	500 毫克	6 小时	2.0 克
由不太敏感的病原菌所引起	1000 毫克	8 小时	3.0 克
的严重和/或威胁生命的感染 (主要为某些绿脓杆菌株)	1000 毫克	6 小时	4.0 克

*对体重<70kg 的病人，给药剂量须进一步按比例降低

†常用于免疫力低下的移植病人、肿瘤化疗病人以及年老体衰病人的轻度感染

由于**本品**有高度的抗菌作用，推荐的每天最高总剂量不超过每天 50 毫克/千克体重或每天 4 克，并择较低剂量使用。然而，在治疗肾功能正常的囊性纤维化病人情况下，**本品**的剂量可用至每天 90 毫克/千克体重，分次给药，但每天不超过 4 克。

本品作为单一用药，已成功治疗了免疫力低下癌症病人的已确定或可疑的感染如脓毒症。

治疗：肾功能损害的成年病人的剂量安排

对治疗肾功能损害的成年病人，可用下列步骤来决定**本品**的减少剂量。

1. 根据感染的特征，从表（一）中选定每日总剂量。
2. 根据表（一）的每日总剂量和病人肌酐清除率范围，再从表（二）中选择合适的剂量。（滴注时间可参阅上述的“治疗：肾功能正常的成年病人的剂

量安排”)

表（二）肾功能损害和体重≥70kg*成年病人使用本品静脉滴注的剂量降低安排

每日总剂量	肌酐清除率 ml/min/1.73m ²		
	41~70	21~40	6~20
1.0 克	250mg 每 8 小时	250mg 每 12 小时	250mg 每 12 小时
1.5 克	250mg 每 6 小时	250mg 每 8 小时	250mg 每 12 小时
2.0 克	500mg 每 8 小时	250mg 每 6 小时	250mg 每 12 小时
3.0 克	500mg 每 6 小时	500mg 每 8 小时	500mg 每 12 小时
4.0 克	750mg 每 8 小时	500mg 每 6 小时	500mg 每 12 小时

- 对体重<70kg 的病人，给药剂量须进一步按比例降低。

当病人的肌酐清除率为 6~20ml/min/1.73m² 时，使用 500 毫克剂量，引起癫痫的危险性可能增加。

若病人的肌酐清除率≤5ml/min/1.73m² 时，除非病人在 48 小时内进行血液透析，否则不应给予**本品**静脉滴注。

血液透析

对治疗肌酐清除率≤5ml/min/1.73m² 且正在进行血液透析的病人，可使用对肌酐清除率为 6–20ml/min/1.73m² 病人的推荐剂量。（参阅“治疗：肾功能损害成年病人的剂量安排”）

亚胺培南和西司他丁在血液透析时从循环中清除。病人在血液透析后应予以**本品**静脉滴注，并于血液透析后以每 12 小时间隔使用一次。尤其是患有中枢神经系统疾病的透析病人，应注意监护；对进行血液透析的病人，只有在使用**本品**静脉滴注治疗的益处大于诱发癫痫发作的危险性时，才推荐使用。（参阅“注意事项”）

目前尚无足够资料推荐**本品**静脉滴注用于腹膜透析的病人。

由于老年病人的肾功能情况不能单靠血清尿素氮或肌酐浓度来精确判断，因此可通过测定肌酐清除率来作为这些病人给药剂量的指导。

预防：成人剂量安排

为预防成人的手术后感染，可在诱导麻醉时给予**本品**静脉滴注 1000 毫克，3 小时后再给予 1000 毫克。对预防高危性（如结肠直肠）外科手术的感染，可在诱

导后 8 小时和 16 小时分别再给予 500 毫克静脉滴注。

对肌酐清除率 $\leq 70\text{ml/min}/1.73\text{m}^2$ 的病人的推荐预防剂量尚无足够的资料。

治疗：儿科剂量的安排（3 个月或较大者）

儿童和婴儿推荐的剂量安排如下：

- (1) 儿童体重 ≥ 40 千克，可按成人剂量给予。
- (2) 儿童和婴儿体重 < 40 千克者，可按 15 毫克/千克，每 6 小时一次给药。

每天总剂量不超过 2 克。

对 3 个月以内的婴儿或肾功能损害的儿科病人（血清肌酐 > 2 毫克/dl），尚无足够的临床资料作为推荐依据。

本品不推荐用于治疗脑膜炎。若怀疑患有脑膜炎者，应选用其它合适的抗生素。

对患脓毒症的儿童，只要能排除脑膜炎的可能，仍然可以使用**本品**。

静脉滴注溶液的配制

供静脉输注用的**本品**静脉滴注剂为瓶装无菌粉末，有两种包装，一种为 120 毫升玻璃瓶装（输液瓶）；另一种为 20 毫升玻璃瓶装（非输液瓶）。每瓶均含 500 毫克亚胺培南和 500 毫克等量的西司他丁。

静脉输注用的**本品**以碳酸氢钠为缓冲剂，使其溶液的 pH 值范围在 6.5~8.5 之间，若按说明来配置和使用，则 pH 值并无明显变化。静脉输注用的**本品**每瓶含钠 37.5 毫克（1.6mEq）。

120 毫升玻璃瓶（输液瓶）

本品 120 毫升玻璃瓶（输液瓶）包装中的无菌粉末应按表（三）所示方法进行配制，并振摇至溶液澄清。从无色至黄色的颜色改变并不影响本品的药效。

表（三） 静脉滴注用的本品输注液的配制

本品静脉滴注的剂量 (亚胺培南 毫克)	加入稀释液的容量 (毫升)	本品静脉滴注液的平均浓度 (亚胺培南 毫克/毫升)
500	100	5

20 毫升玻璃瓶（非输液瓶）

本品 20 毫升玻璃瓶（非输液瓶）包装中的无菌粉末应按以下方法进行配制：

瓶中的内容物必须先配制成混悬液，再转移至 100 毫升合适的输注液中。

推荐的步骤为从装有 100 毫升稀释液（见本品输注液的稳定性）的输注容器中取

出 10 毫升，加入本品 20 毫升瓶中，摇匀。将混悬液转移至输注容器中。

注意：混悬液不能直接用于输液。

重复上述步骤一次保证 20 毫升玻璃瓶中的内容物完全转移至输注溶液中。**充分振摇输注容器直至溶液澄清。**

本品输注液的稳定性

干粉剂需在室温下 (E.P.=15~25℃) 贮存。

表 (四) 为选用不同滴注溶液配制成**本品**静脉滴注液，分别在室温或冷藏条件下的稳定期限。

注意：静脉滴注用的**本品**化学特性与乳酸盐不相容，因此使用的稀释液不能含有乳酸盐；但可经正在进行乳酸盐滴注的静脉输液系统中给药。

本品静脉滴注不能与其它抗生素混合或直接加入其它抗生素中使用。

表 (四) 静脉滴注本品输注液配制后的稳定性

稀释液	稳定期限	
	室温 (25℃)	冷藏 (4℃)
等渗氯化钠溶液	4 小时	24 小时
5%葡萄糖溶液	4 小时	24 小时
10%葡萄糖溶液	4 小时	24 小时
5%葡萄糖和 0.9%氯化钠溶液	4 小时	24 小时
5%葡萄糖和 0.45%氯化钠溶液	4 小时	24 小时
5%葡萄糖和 0.225%氯化钠溶液	4 小时	24 小时
5%葡萄糖和 0.15%氯化钾溶液	4 小时	24 小时
5%和 10%甘露醇	4 小时	24 小时

[不良反应]

一般来说，**本品**的耐受性良好。临床对照研究显示，**本品**的耐受性与头孢唑啉、头孢噻吩和头孢噻肟一样良好。副作用大多轻微而短暂，很少需要停药，极少出现严重的副作用。最常见的不良反应是一些局部反应。

以下为临床研究和上市后经验报告的不良反应。

局部反应

红斑、局部疼痛和硬结，血栓性静脉炎。

过敏反应/皮肤

皮疹、搔痒、荨麻疹、多形性红斑、约翰逊综合征、血管性水肿、中毒性表皮坏死（罕见）、表皮脱落性皮炎（罕见）、念珠菌病、发热包括药物热及过敏反应。

胃肠道反应

恶心、呕吐、腹泻、牙齿和/或舌色斑。与使用其它所有广谱抗生素一样，已有报道本品可引起伪膜性结肠炎。

血液

嗜酸细胞增多症、白细胞减少症、中性白细胞减少症，包括粒细胞缺乏症，血小板减少症、血小板增多症、血红蛋白降低和全血细胞减少症，以及凝血酶原时间延长均有报导。部分病人可能出现直接 Coombs 试验阳性反应。

肝功能

血清转氨酶、胆红素和/或血清碱性磷酸酶升高；肝衰竭（罕见），肝炎（罕见）和暴发性肝炎（极罕见）。

肾功能

少尿/无尿、多尿、急性肾功能衰竭（罕见）。由于这些病人通常已有导致肾前性氮质血症或肾功能损害的因素，因此难以评估本品对肾功能改变的作用。

已观察到本品可引起血清肌酐和血尿毒氮升高的现象；尿液变色的情况是无害的，不应与血尿混淆。

神经系统/精神疾病

与其它 β-内酰胺抗生素一样，已有报道本品可引起中枢神经系统的副作用，如肌阵挛、精神障碍，包括幻觉、错乱状态或癫痫发作，感觉异常和脑病亦有报导。

特殊感觉

听觉丧失，味觉异常。

粒细胞减少的病人

与无粒细胞减少症的病人相比，在粒细胞减少的病人中使用本品静脉滴注更常出现药物相关性的恶心和/或呕吐症状。

[禁忌]

本品禁用于对本品任何成份过敏的病人。

[注意事项]

一般使用

一些临床和实验室资料表明，**本品**与其它 β -内酰胺类抗生素、青霉素类和头孢菌素类抗生素有部分交叉过敏反应。已报道，大多数 β -内酰胺抗生素可引起严重的反应（包括过敏性反应）。因此，在使用**本品**前，应详细询问病人过去有无对 β -内酰胺抗菌素的过敏史。若在使用**本品**时出现过敏反应，应立即停药并作相应处理。

有文献报道，合并碳青霉烯类用药，包括亚胺培南，患者接受丙戊酸或双丙戊酸钠会导致丙戊酸浓度降低。因为药物相互作用，丙戊酸浓度会低于治疗范围，因此癫痫发作的风险增加。增加丙戊酸或双丙戊酸钠的剂量并不足以克服该类相互作用。一般不推荐亚胺培南与丙戊酸/双丙戊酸钠同时给药。当患者癫痫发作经丙戊酸或双丙戊酸钠良好控制后，应考虑非碳青霉烯类的其他抗生素用于治疗感染。如果必需使用**本品**，应考虑补充抗惊厥治疗(参阅 **药物相互作用**)。

事实上，已有报告几乎所有抗生素都可引起伪膜性结肠炎，其严重程度由轻度至危及生命不等。因此，对曾患过胃肠道疾病尤其是结肠炎的病人，均需小心使用抗生素。对在使用抗菌素过程中出现腹泻的病人，应考虑诊断伪膜性结肠炎的可能。有研究显示，梭状芽孢杆菌所产生的毒素是在使用抗菌素期间引起结肠炎的主要原因，但也应予以考虑其它原因。

中枢神经系统

本品与其它 β -内酰胺类抗生素一样，可产生中枢神经系统的副作用，如肌肉阵挛、精神错乱或癫痫发作，尤其当使用剂量超过了根据体重和肾功能状态所推荐的剂量时。但这些副作用大多发生于已有中枢神经系统疾患的病人（如脑损害或有癫痫病史）和/或肾功能损害者，因为这些病人会发生药物蓄积。因此，需严格按照推荐剂量安排使用，尤其上述病人（见“用法用量”）。已有癫痫发作的病人，应继续使用抗惊厥药来治疗。

如发生病灶性震颤、肌阵挛或癫痫时，应作神经病学检查评价；如原来未进行抗惊厥治疗，应给予治疗。如中枢神经系统症状持续存在，应减少**本品**的剂量或停药。

肌酐清除率 $\leq 5\text{ml}/\text{min}/1.73\text{m}^2$ 的病人不应使用**本品**，除非在 48 小时内进行血液透析。血液透析病人亦仅在使用**本品**的益处大于癫痫发作的危险性时才可考虑。

[孕妇及哺乳期妇女用药]

在怀孕妇女使用**本品**方面，尚未有足够及良好对照的研究资料，只有考虑在对胎儿益处大于潜在危险的情况下，才能在妊娠期间给药。

哺乳期妇女

在人乳中可测出亚胺培南，如确定有必要对哺乳期妇女使用**本品**时，病人需停止授乳。

[儿童用药]

目前尚无足够的临床资料可推荐**本品**用于 3 个月以下的婴儿或肾功能损害（血清肌酐 $>2\text{mg}/\text{dl}$ ）的儿科病人（请参阅用法用量中的“儿科剂量的安排”）。

[老年用药]

本品不需根据年龄调整用药剂量。由于老年患者更易患有肾功能衰退，应慎重选择用药剂量。监测患者的肾功能可能是有效途径。对肾功能损害的病人进行用药剂量调整是必要的。（请参阅用法用量中相关内容。治疗：肾功能损害的成年病人的剂量安排）。

[药物相互作用]

已有使用 ganciclovir 和**本品**静脉滴注于病人引起癫痫发作的报道。对于这种情况除非其益处大于危险，否则不应伴随使用。

也可参阅[用法用量]下“本品输注液的稳定性”。

有文献表明，合并碳青霉烯类用药，包括亚胺培南，患者接受丙戊酸或双丙戊酸钠会导致丙戊酸浓度降低。因为药物相互作用，丙戊酸浓度会低于治疗范围，

因此癫痫发作的风险增加。尽管药物相互作用的机制尚不明确，体外和动物研究数据表明，碳青霉烯类药物会抑制丙戊酸葡萄糖苷酸代谢（VPA-g）成丙戊酸的水解，降低丙戊酸的血清浓度。（参阅 **注意事项**）

[药物过量]

尚无有关处理**本品**治疗过量的特殊资料。亚胺培南西司他丁钠盐可通过血液透析清除，但在剂量过大时这种措施对处理**本品**药物过量是否有用尚不得而知。

[药理毒理]

本品是一种广谱的 β -内酰胺类抗生素。以静脉滴注剂型供应。**本品**含有两种成份：（1）亚胺培南，为一种最新型的 β -内酰胺类抗生素——亚胺硫霉素；（2）西司他丁钠，为一种特异性酶抑制剂，它能阻断亚胺培南在肾脏内的代谢，从而提高泌尿道中亚胺培南原形药物的浓度。在**本品**中亚胺培南与西司他丁钠的重量比为 1:1。

亚胺培南是属于亚胺硫霉素类抗生素，其显著特点是杀菌谱较其它任何已研究过的抗生素更为广泛。

微生物学

本品的广谱杀菌作用是由于其具有强大的抑制细菌细胞壁合成的能力。可杀灭绝大部分革兰氏阳性和革兰氏阴性的需氧和厌氧病原菌。

本品除与新一代头孢菌素类和青霉素类一样具有对革兰氏阴性细菌广谱的抗菌活性外，对革兰氏阳性细菌也有强效杀灭能力；而此种特性只有在较早期窄谱的 β -内酰胺类抗生素才具有。**本品**的抗菌谱包括绿脓杆菌、金黄色葡萄球菌、粪肠球菌和脆弱拟杆菌在内的不同种类的病原体，而这些病原体通常易对其它抗生素产生耐药性。

本品有对抗细菌产生的 β -内酰胺酶的降解能力，使其能对大部分病原体，如绿脓杆菌、沙雷氏杆菌属和肠杆菌属等具有明显的抗菌作用；而这些病原体对大多数 β -内酰胺类抗生素具有天然耐药性。

本品的抗菌谱比其它任何已研究过的抗生素更广泛，实际上包括了所有在临床上

有意义的病原菌。本品在体外的抗菌范围包括：

革兰氏阴性需氧菌

无色杆菌属

不动杆菌属（以前称小小赫尔菌属）

嗜水气单胞菌

产碱杆菌属

支气管博代氏杆菌

支气管败血症博代氏杆菌

博代百日咳杆菌

马耳他布鲁氏杆菌

类鼻疽伯克霍尔德菌（以前称类鼻疽假单胞菌）

施氏伯克霍尔德菌（以前称施氏假单胞菌）

弯曲杆菌属

嗜二氧化碳噬细胞菌属

柠檬酸细菌属

弗氏柠檬酸菌

克氏柠檬酸菌（以前称多样性柠檬酸菌）

分外埃肯杆菌族

肠杆菌属

产气杆菌

聚团肠杆菌

阴沟肠杆菌

大肠杆菌

阴道加德诺菌属

杜克嗜血杆菌

流感嗜血杆菌（包括产 β -内酰胺酶菌株）

副流感嗜血杆菌

蜂房哈夫尼菌

克雷白氏杆菌属

奥克西托克雷白氏杆菌
臭鼻克雷白杆菌
肺炎杆菌
莫拉菌属
摩氏摩根菌（以前称摩氏变形菌）
淋病奈瑟球菌（包括产生青霉素酶菌株）
脑膜炎奈瑟氏球菌
巴斯德菌属
多杀巴氏杆菌
类志贺邻单胞菌
变形杆菌属
奇异变形杆菌
普通变形杆菌
普罗威登斯菌属
产碱普罗威登斯菌属
雷氏普罗威登斯菌（以前称雷氏变形菌）
斯氏普罗威登斯菌
假单胞菌属**
绿脓杆菌
荧光假单胞菌
恶臭假单胞菌
沙门氏菌属
伤寒沙门氏菌
沙雷氏菌属
变斑沙雷氏菌（以前称液化沙雷氏菌）
粘质沙雷氏菌
志贺氏菌属
涅尔森氏菌属（以前称巴斯德杆菌）
小肠结肠炎涅尔森氏菌

假结核涅尔森氏菌

嗜麦芽寡养单胞菌（以前称嗜麦芽窄食单胞菌，嗜麦芽假单胞菌）和一些洋葱伯克霍尔德菌（以前称洋葱假单胞菌）一般对本品**不敏感。

革兰氏阳性需氧菌

芽胞杆菌属

粪肠球菌

猪丹毒丹毒丝菌

单核细胞增多性李斯德菌

奴卡氏菌属

小球菌属

金黄色葡萄球菌（包括产生青霉素酶菌株）

表皮葡萄球菌（包括产生青霉素酶菌株）

腐生性葡萄球菌

无乳链球菌

链球菌 C 族

链球菌 G 族

肺炎链球菌

酿脓链球菌

甲型溶血性链球菌（包括 A 群溶血性链球菌及 B 群溶血性链球菌）

屎肠球菌及对甲氧西林耐药的葡萄球菌对**本品**不敏感。

革兰氏阴性厌氧菌

拟杆菌属

吉氏拟杆菌

脆弱拟杆菌

卵形拟杆菌

多形拟杆菌

单形拟杆菌

普通拟杆菌

Bilophila wadsworthia

梭形杆菌属

坏疽梭形杆菌

核梭形杆菌

非解糖红棕单胞菌（以前称非解糖拟杆菌）

二路普雷沃氏菌（以前称双道拟杆菌）

解糖豚普雷沃氏菌（以前称狄氏拟杆菌）

中间普雷沃氏菌（以前称中间拟杆菌）

产黑色素普雷沃氏菌（以前称产黑素拟杆菌）

韦荣球菌属

革兰氏阳性厌氧菌

放线菌属

双歧杆菌属

梭状芽胞杆菌属

产气荚膜梭状芽胞杆菌

真杆菌属

乳杆菌属

动弯杆菌属

微需氧链球菌

消化球菌属

消化链球菌属

丙酸杆菌属（包括痤疮丙酸杆菌）

其他

分枝杆菌

包皮垢分枝杆菌

体外试验表明，亚胺培南与氨基糖甙类抗生素对抗某些分离的绿脓杆菌有协同作用。

[药代动力学]

静脉输注给药

亚胺培南

给健康受试者静脉输注泰能 250mg, 500mg, 1000mg 二十分钟后, 亚胺培南的血药峰浓度范围分别为: 12 到 20mcg/mL, 21 到 58 mcg/mL, 41 到 83 mcg/mL, 对应的平均血药峰浓度分别为 17, 39 和 66 mcg/mL。4 到 6 小时内亚胺培南血浆浓度下降到 1 mcg/mL 以下或更低。

亚胺培南的血浆半衰期是 1 小时。在 10 小时内, 约 70% 的亚胺培南在尿中以原药形式重吸收, 随后在尿中就检测不到药物排泄。在给予健康受试者 500 毫克剂量的泰能 8 小时后, 亚胺培南的尿中浓度超过 10 mcg/mL。

亚胺培南的剩余部分 (不具抗菌活性的亚胺培南代谢物) 在尿中回收, 通过粪便排泄清除的亚胺培南基本为零。

参照泰能的用药方式, 肾功能正常病人每 6 小时给予亚胺培南一次没有观测到其在血浆或尿中蓄积。泰能和二丙苯磺胺同时给药可少许增加亚胺培南的血浆水平和血浆半衰期。泰能和二丙苯磺胺联合用药使具有抗菌活性 (未代谢的) 的亚胺培南尿中回收率减少到给药剂量的约 60%。

单独给药时, 亚胺培南在肾脏中通过脱氢肽酶-1 代谢。对于每个个体, 尿中亚胺培南回收率从 5% 到 40%, 在多个试验中, 则其平均回收率范围是从 15% - 20%。

亚胺培南与人血清蛋白的结合率约为 20%。

静脉输注 1g 泰能后亚胺培南的组织 and 体液浓度

取样部位	组织内的含量 (mcg/mL 或 mcg/g)	取样时间 (hr)
玻璃体	3.4	3.5
房水	2.99	2.0
肺组织	5.6	1.0
痰	2.1	1.0
胸膜	22.0	1.0
腹膜	23.9	2.0
胆汁	5.3	2.25
脑脊液	正常	4.0
	炎性	2.0
前列腺液	0.2	1.0 - 1.5
前列腺组织	5.3	1.0 - 2.75
输卵管	13.6	1.0
子宫内膜	11.1	1.0
子宫肌层	5.0	1.0
骨骼	2.6	1.0
组织间液	16.4	1.0
皮肤	4.4	1.0

筋膜	4.4	1.0
----	-----	-----

西司他丁

西司他丁是肾脏中脱氢肽酶-1 的特异性抑制剂，能有效减少亚胺培南代谢，因此亚胺培南和西司他丁同时给药可使尿和血浆中都能达到具有抗菌作用的亚胺培南浓度。

静脉输注泰能 250mg，500mg，1000mg 二十分钟后，西司他丁的血药峰浓度范围分别为：21 到 26mcg/mL，21 到 55 mcg/mL，56 到 88mcg/mL,对应的平均血药峰浓度分别为 22，42 和 72mcg/mL。西司他丁的血浆半衰期约为 1 小时。胃肠外给药 10 小时后约 70—80% 给药剂量的西司他丁在尿中完整回收。此后，尿中没有再检测出西司他丁。约 10% 给药剂量的西司他丁最后成为 N-乙酰基代谢物。这种 N-乙酰基代谢物抑制脱氢肽酶活性与其母体药物相当。因此当西司他丁从血液中消除后，肾脏中脱氢肽酶-1 的活性很快就恢复到正常水平。

泰能和二丙苯磺胺同时给药后的西司他丁血浆浓度和半衰期比单独给药要高一倍。但是对西司他丁在尿中的回收率没有影响。

西司他丁与人血清蛋白的结合率约为 40%。

[贮藏]

密闭，25℃以下保存。

[包装]

玻璃瓶。

亚胺培南 500mg 和西司他丁钠（以 $C_{16}H_{26}N_2O_5S$ 计）500mg /瓶，1 瓶/盒。

[有效期]

24 个月。

[执行标准]

进口药品注册标准 JX20060135

[批准文号]

国药准字 J20080047（120mL）

国药准字 J20080046（20mL）

进口药品注册证号:

H20080070 (120mL)

H20080071 (20mL)

[生产企业]

企业名称: Merck & Co., Inc.

企业地址: Whitehouse Station, N.J., U.S.A.

生产厂: Merck & Co., Inc.

生产厂地址: PO Box 7, Elkton, VA 22827, U.S.A.

分装厂: 杭州默沙东制药有限公司

分装厂地址: 浙江省杭州市莫干山路 864 号

邮政编码: 310011

联系电话: 021-22118888

传真号码: 021-22118500