

核准日期: 2007.03.27  
修改日期: 2010.10.01  
修改日期: 2015.04.23  
修改日期: 2015.12.01  
修改日期: 2020.11.01  
修改日期: 2020.12.01  
修改日期: 2021.11.15  
修改日期: 2021.12.10  
修改日期: 2022.10.25  
修改日期: 2023.02.13  
修改日期: 2023.05.28



# 复方磺胺甲噁唑片说明书

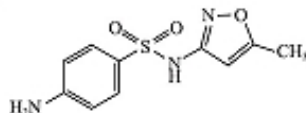
请仔细阅读说明书并在医师指导下使用。

## 【药品名称】

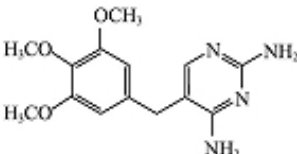
通用名称: 复方磺胺甲噁唑片  
英文名称: Compound Sulfamethoxazole Tablets  
汉语拼音: Fufang Huang'ang Jia'ao Pian

## 【成份】

本品为复方制剂,其组分为每片含磺胺甲噁唑0.4g和甲氧苄啶80mg。  
化学名称: 磺胺甲噁唑: N-(5-甲氧基-3-异噁唑基)-4-氨基苯磺酰胺  
甲氧苄啶: 5-[(1,3,5-三甲氧基苯基)甲基]-2,4-嘧啶二胺  
化学结构式:  
磺胺甲噁唑:



甲氧苄啶:



分子式: 磺胺甲噁唑:  $C_{10}H_{11}N_3O_5S$ ; 甲氧苄啶:  $C_{15}H_{19}N_5O_3$   
分子量: 磺胺甲噁唑: 253.28; 甲氧苄啶: 296.32

## 【性状】

本品为白色片。

## 【适应症】

近年来由于许多临床常见病原体对本品呈现耐药,故治疗细菌感染需参考药敏结果。本品的主要适应症为敏感菌株所致的下列感染:

1. 大肠埃希菌,克雷伯菌属,肠杆菌属,奇异变形杆菌,普通变形杆菌和摩根菌属的尿路感染及细菌性前列腺炎。
2. 肺炎链球菌或流感嗜血杆菌所致2岁以上小儿急性中耳炎。在任何年龄的中耳炎患者中,本品均不适用于预防或根治治疗。
3. 肺炎链球菌或流感嗜血杆菌所致成人慢性支气管炎急性发作。
4. 由肺炎衣原体或流感嗜血杆菌引起的呼吸道感染,支气管炎。
5. 可用于治疗肺炎链球菌肺炎,也可用于免疫功能低下和肺炎链球菌肺炎高危患者的预防。
6. 由产肠毒素大肠杆菌所致成人旅行者腹泻。

## 【用法用量】

磺胺甲噁唑 0.4g, 甲氧苄啶 80mg  
【用法用量】  
1. 成人常用量 治疗细菌性感染,一次磺胺甲噁唑 800mg 和甲氧苄啶 160mg, 每 12 小时服用 1 次。治疗耶氏肺炎球菌肺炎,一次磺胺甲噁唑 18.75 ~ 25mg/kg 和甲氧苄啶 3.75 ~ 5mg/kg, 每 6 小时服用 1 次。成人预防用药: 初治磺胺甲噁唑 800mg 和甲氧苄啶 160mg, 一日 2 次, 继以相同剂量一日服 1 次, 或一服 2 次。  
2. 小儿常用量 2 岁以下婴幼儿禁用。治疗细菌性感染, 2 个月以上体重 40kg 以下的婴幼儿按体重口服一次磺胺甲噁唑 20 ~ 30mg/kg 及甲氧苄啶 4 ~ 6mg/kg, 每 12 小时 1 次; 体重 ≥ 40kg 的小儿剂量同成人常用量。治疗耶氏肺炎球菌肺炎, 按体重一次口服磺胺甲噁唑 18.75 ~ 25mg/kg 及甲氧苄啶 3.75 ~ 5mg/kg, 每 6 小时 1 次。  
慢性支气管炎急性发作时的疗程至少 10 ~ 14 日; 尿路感染的疗程 7 ~ 10 日; 预防性治疗的疗程为 5 ~ 7 日; 儿童急性中耳炎的疗程为 10 日; 耶氏肺炎球菌肺炎的疗程为 14 ~ 21 日。

## 【不良反应】

最常见的不良反应是胃肠道紊乱(恶心、呕吐、厌食)和皮肤过敏反应(如皮疹和荨麻疹)。因使用磺胺类药物致死的病例虽然罕见,但可由严重的不良反应引起,如 Stevens-Johnson 综合征,中毒性表皮坏死脱落症,暴发性肝炎,粒细胞缺乏症,再生障碍性贫血和其他血液疾病(见【注意事项】)。  
血液系统: 粒细胞缺乏症,再生障碍性贫血,血小板减少症,白细胞减少症,中性粒细胞减少症,溶血性贫血,巨细胞性贫血,低凝血酶原血症,高铁血红蛋白血症,嗜酸性粒细胞增多症。  
过敏反应: Stevens-Johnson 综合征,中毒性表皮坏死脱落症,过敏性休克,过敏性心肌炎,多形性红斑,剥脱性皮炎,血管性水肿,药物热,寒战,过敏性紫癜,血清病样综合征,全身性过敏反应,全身性皮疹,光敏症,结膜和角膜充血,瘙痒,荨麻疹,皮疹。此外,结节性动脉周围炎和系统性红斑狼疮也有报道。  
胃肠道: 肝炎(包括胆汁淤积性黄疸、肝坏死),血清转氨酶和胆红素升高,偶发性肠炎,肠炎,口臭,舌炎,恶心,呕吐,腹痛、腹泻、厌食。  
泌尿生殖系统: 肾功能衰竭,间质性肾炎,血尿,血尿酸和血酒精肝升高,中毒性肾病,少尿和无尿,与电解质相关的电解质紊乱。  
代谢和营养: 高钾血症,低钾血症(见【注意事项】)。  
神经系统: 无菌性脑膜炎,抽搐,因精神紧张,共济失调,眩晕,耳鸣,头痛,精神紧张,幻觉,抑郁,焦虑,紧张。  
内分泌: 磺胺类药物与某些甲状腺激素,利尿剂(乙酰唑胺和噻嗪类)和口服降糖药有一定的化学相似性,这些药物可能存在交叉敏感性。服用磺胺类药物的患者很少发生多尿和低血糖。  
肌肉骨骼: 关节痛和肌痛。已有使用复方磺胺甲噁唑发生横纹肌溶解的个别病例报道,主要发生于文迪病惠者。

呼吸: 哮喘,呼吸急促和肺浸润(见【注意事项】)。

其他: 虚弱,疲乏,失眠。

上市后经验:

在甲氧苄啶-磺胺甲噁唑上市后发现以下不良反应,因为报告这些不良反应的人例数不明确,因此无法计算其发生率以及是否与药物相关。

- 血栓性血小板减少性紫癜
- 特发性血小板减少性紫癜
- QT 延长导致室性心动过速和尖端扭转型室速

## 【禁忌】

1. 对甲氧苄啶或磺胺类药物过敏者禁用。
2. 曾经因使用甲氧苄啶和/或磺胺类药物导致血小板减少的患者禁用。
3. 由于本品阻止叶酸的代谢,加重巨幼红细胞性贫血患者叶酸的缺乏,所以该病惠者禁用本品。
4. 孕妇及哺乳期妇女禁用本品。
5. 小于 2 个月的婴儿禁用本品。
6. 重症肝肾功能损害者禁用本品。

## 【注意事项】

1. 胚胎毒性  
一项流行病学研究表明,早期接触磺胺甲噁唑/甲氧苄啶可能会增加先天性畸形的风险,尤其是神经管缺陷,心血管畸形,泌尿道畸形,口腔裂和畸形,如果在怀孕期间使用磺胺甲噁唑/甲氧苄啶,或者患者在服用此药时怀孕,应在告知患者对胎儿的潜在危害。  
2. 过敏和其他致命反应  
因使用磺胺类药物致死的病例虽然罕见,但可由严重的不良反应而导致,如 Stevens-Johnson 综合征,中毒性表皮坏死脱落症,暴发性肝炎,粒细胞缺乏症,再生障碍性贫血和其他血液疾病。  
应在首次出现皮疹或任何不良反应迹象时停用磺胺类药物(包括含磺胺成分的药品,如磺胺甲噁唑/甲氧苄啶)。在极少数情况下,皮疹之后可能会出现更严重的反应,如 Stevens-Johnson 综合征,中毒性表皮坏死脱落症,肝坏死和严重的血液疾病。临床症状(如皮疹,喉痛,发热,关节痛,面色苍白,紫癜或黄疸)可能是严重反应的早期迹象。  
咳嗽,呼吸急促和肺浸润已被报道与磺胺类药物用于治疗有关的呼吸过敏反应。

## 3. 血小板减少症

磺胺甲噁唑/甲氧苄啶导致的血小板减少可能是一种免疫介导的疾病。致死性或危及生命的严重血小板减少症也有报道。血小板减少症通常在停用磺胺甲噁唑/甲氧苄啶后一周内消失。

## 4. 特殊感染和风湿热

磺胺类药物不应用于治疗 A 组 β-溶血性链球菌感染。对于明确感染的患者,由于其不能清除病原体,因此不能预防风湿热等后遗症。

## 5. 艰难梭状芽孢杆菌相关性腹泻(CDAD)

几乎所有抗菌药物(包括复方磺胺甲噁唑)的应用都有艰难梭状芽孢杆菌相关性腹泻(CDAD)的报告,其严重程度可表现为轻度腹泻至致死性结肠炎。抗菌药物的使用可引起结肠内正常菌群的改变,导致艰难梭状芽孢杆菌过度繁殖。  
艰难梭状芽孢杆菌产生的毒素 A 和毒素 B 与 CDAD 的发病有关。产生毒素的艰难梭状芽孢杆菌可导致发病率和死亡率升高。这些感染可能难以用抗菌药物治疗,因此可能需要进行结肠切除术。对于所有使用抗生素后出现腹泻的患者,必须考虑到 CDAD 的可能。由于曾经有给予抗菌药物治疗超过 2 个月发生 CDAD 的报道,因此需仔细询问病史。  
如果怀疑或确诊 CDAD,需考虑停用并非针对艰难梭状芽孢杆菌的抗生素。根据临床症状进行适当的液体和电解质管理,蛋白质补充,针对艰难梭状芽孢杆菌的抗生素治疗和外科手术治疗。

## 6. 甲氧苄啶抑制肠蠕动治疗耶氏肺炎球菌肺炎

在一项随机安慰剂对照试验中,使用甲氧苄啶-磺胺甲噁唑联合苄唑啉酸治疗 HIV 阳性的耶氏肺炎球菌肺炎患者,观察到治疗失败和死亡率增加。在治疗耶氏肺炎球菌肺炎时应避免同时给予甲氧苄啶-磺胺甲噁唑和四氢吡啶。

## 7. 耐药性的产生

在尚未确诊或高度怀疑细菌感染的情况下,以及不符合预防适应症的情况下,服用本品可能不会为患者带来益处,并可增加产生耐药菌的风险。

## 8. 叶酸缺乏

对于肾功能受损或接受透析的患者,可能存在叶酸缺乏的患者(如老年人,长期酗酒者,接受透析治疗的患者,吸收不良综合征患者,营养不良患者)以及严重过敏或支气管哮喘患者,应谨慎使用本品。  
老年患者,有叶酸缺乏史的患者或肾功能衰竭的患者,可能会出现血液学异常提示叶酸缺乏,可通过补充叶酸进行治疗。

## 9. 贫血

葡萄糖-6-磷酸脱氢酶缺乏的患者可能发生溶血,这种情况通常与剂量相关。

## 10. 低血糖

糖尿病患者服用复方磺胺甲噁唑后出现低血糖的现象罕见,通常在治疗几天后发生。肾功能障碍,肝病,营养不良或接受大剂量复方磺胺甲噁唑的患者尤其容易发生。

## 11. 茶内酰胺代谢

甲氧苄啶可影响茶内酰胺代谢,但对合理限制饮食的茶内酰胺患者无影响。

## 12. 嗜铬细胞瘤和甲状旁腺功能减退

与其他缩血管药物一样,本品用于嗜铬细胞瘤或甲状旁腺功能减退患者需谨慎。

## 13. 预防及治疗获得性免疫缺陷综合征(AIDS)患者的耶氏肺炎球菌肺炎

艾滋病患者对复方磺胺甲噁唑的耐受和反应程度与非艾滋病患者不同。据报道,与服用复方磺胺甲噁唑治疗的非艾滋病患者相比,正在接受耶氏肺炎球菌肺炎治疗的艾滋病患者,使用复方磺胺甲噁唑治疗的不耐受(尤其是皮疹,发热,白蛋白减少和转氨酶升高)的发生率显著增加。在接受复方磺胺甲噁唑用于预防的患者中,不良耐受发生率不严重。既往对复方磺胺甲噁唑有轻度不受耐受的艾滋病患者,似乎不能预测在之后二级预防中是否不耐受。但是,如果患者出现皮疹或任何不良反应迹象,应重新评估复方磺胺甲噁唑的治疗。在治疗耶氏肺炎球菌肺炎时应避免联用

#### 甲氧苄啶

##### 14. 电解质异常

高剂量的甲氧苄啶用于耶氏肺炎球菌肺炎患者，会导致大量患者血钾浓度的逐步但可逆性升高。当甲氧苄啶用于正在服用利尿剂患者、肾功能不全患者或服用可引发高钾血症的药物时，即使是推荐剂量也可能引起高钾血症。这些患者需要密切监测血钾。

接受复方磺胺甲噁唑治疗的患者（尤其是治疗耶氏肺炎球菌肺炎患者）可能出现严重的症状性低血钾。对有症状的患者进行血清钾的评估和纠正，以防止出现危及生命的并发症，是极有必要的。

在治疗过程中，应保证足够的液体摄入量，以防止结晶尿。“慢乙酰化”的病人可能更容易对磺胺类药物产生不良反应。

##### 15. 实验室检查

接受本品治疗的患者应常规进行全血细胞计数。如果发现任何成分数量显著减少，应停药本品。治疗过程中应进行尿液检查和肾功能检查，尤其是肾功能损害患者。

##### 【孕妇及哺乳期妇女用药】

1. 本品可穿过胎盘屏障至胎儿体内，动物实验发现有致畸作用。人类中研究缺乏充足资料，孕妇应避免应用。

2. 本品可自乳汁中分泌，乳汁中浓度的可达母体血清浓度的50%~100%。药物可能对婴儿产生影响。本品在哺乳期、6-磷酸脱氢酶缺乏症新生儿中应用有导致溶血性贫血发生的可能。鉴于上述原因，哺乳期妇女不宜应用本品。

##### 【儿童用药】

由于本品可与胆红素竞争在血浆蛋白上的结合部位，而新生儿肝脏代谢系统未发育完善，磺胺类药物血药浓度增高，以致增加了核黄疸发生的危险性。因此该类药在新生儿及2个月以下婴儿的应用属禁忌。儿童处于生长发育期，肝肾功能还不完善，用药应慎重。

##### 【老年用药】

老年患者发生严重不良反应的风险可能增加，尤其是当存在复杂情况时，如肾功能减退或肝功能受损，可能的尿酸盐沉积或同时使用其他药物。严重的皮肤反应，广泛性骨髓抑制，血小板异常性下降（有文献称）和高钾血症是老年患者最常见的严重不良反应。已有报道，在同时接受某些利尿剂（主要是噻嗪类）的患者中，血小板减少合并紫癜的发生率增加。复方磺胺甲噁唑和高钾血症会增加老年患者的血药浓度，尤其是老年患者，应对最高浓度的药物浓度进行监测。老年患者可能会出现血液学异常提示叶酸缺乏，可通过补充叶酸进行治疗。肾功能受损的患者应进行适当的剂量调整，服药期间应尽可能增加，以尽量减少不良反应的风险。

当用于正在服用利尿剂患者、肾功能不全患者或服用可引发高钾血症药物（如血管紧张素转换酶抑制剂）的患者，复方磺胺甲噁唑中的甲氧苄啶可导致高钾血症。这些患者需要密切监测血钾，建议停止复方磺胺甲噁唑治疗以降低血清钾水平。因此老年患者应避免使用，确有症状时请及时就医处理。

##### 【药物相互作用】

1. 甲氧苄啶是 CYP2C8 抑制剂以及 OCT2 转运载体。磺胺甲噁唑是 CYP2C9 抑制剂。复方磺胺甲噁唑与底物是 CYP2C8、CYP2C9 和 OCT2 的药物合用。

2. 下列药物与本品合用时，本品可取代这些药物的蛋白结合部位，或抑制其代谢，以致药物作用时间延长或发生毒性反应。因此当这些药物与本品合用，或在应用本品之后使用时应谨慎其剂量。此类药物包括口服抗凝药、口服降糖药、甲氧唑醇、苯妥英钠和磺胺类药物。

接受抗凝药华法林（CYP2C9 底物）的患者，本品可延长凝血酶原时间，凝血时间应重新评估。

复方磺胺甲噁唑可能抑制苯妥英（CYP2C8 底物）的肝代谢，其以普通临床剂量给药，使苯妥英血浆浓度提高了 39%，苯妥英代谢清除率降低了 27%，合用时，应注意苯妥英可能浓度增加的影响。

与甲氧苄啶竞争肾运输的血浆蛋白结合位点，从而增加游离甲氧苄啶的浓度。

3. 据报道与磺胺类药物中，复方磺胺甲噁唑和环丙沙星合用有有益但可逆的肾毒性。

4. 复方磺胺甲噁唑治疗可增加地高辛血清水平，特别是老年患者。应监测血清地高辛水平。

5. 在接受利尿剂的患者中可能会出现磺胺甲噁唑的血药水平升高。

6. 有报告表明，患者接受乙酰唑胺作为预防性药物，每周服用超过 25mg，与复方磺胺甲噁唑合用时可能会出现巨细胞性贫血。

7. 复方磺胺甲噁唑可增强 CYP2C8（例如格列格列酮，瑞格列奈和罗格列酮）或 CYP2C9（短效利尿剂和格列本胺）代谢，增强通过 OCT2（如二甲双胍）肾上排率代谢的口服降糖药作用，需要密切监测血糖。

8. 在文献中，有合用磺胺甲噁唑/甲氧苄啶和金霉素（OCT2 底物）后出现确实的骨髓抑制，这报道了与其他 OCT2 底物、金霉素和二巯基相互作用的前例。

9. 在文献中，磺胺甲噁唑/甲氧苄啶和血管紧张素转换酶抑制剂合用后，有报告 3 例老年患者出现高钾血症。

10. 合用尿酸化剂可增加本品在碱性尿中的溶解度，使排泄增多。

11. 不能与对氨基苯甲酸合用，对氨基苯甲酸可代替本品被细菌摄取，两者相互拮抗。

12. 与骨髓抑制药合用可能增强此类药物对造血系统的不良反应，如白细胞、血小板减少等，如确有指征两药同用时，应严密观察可能发生的毒性反应。

13. 与避孕药（雌激素类）长时间合用可导致避孕的可靠性减少，并增加不规则出血的机会。

14. 与给糖药物合用时，可能增大其潜在的毒性作用。

15. 与肝毒性药物合用时，可能引起肝毒性发生率增高。对此类患者尤其是用药时间较长及以往有胆病史者应监测肝功能。

16. 与光敏药物合用时，可能发生光敏作用相加。

17. 接受本品治疗者对维生素 K 的需要量增加。

18. 不宜与乌洛托品合用，因为乌洛托品在酸性尿中可分解产生甲醛，后者可与本品形成不溶性沉淀物，使发生结晶尿的危险性增加。

19. 本品可取代保泰松的血浆蛋白结合部位，当两者合用时可增强保泰松的作用。

20. 磺胺类与本品合用时可减少后者肾小管的分泌，其血药浓度持久并易产生毒性反应，因此在应用磺胺类药物或在应用其治疗时应调整本品的剂量。当磺胺类药物较长时，对本品的血药浓度宜进行监测，有助于剂量的调整，保证安全用药。

21. 利福平与本品合用时，可明显使本品中的 TMP 清除增加和血清半衰期缩短。

22. 不宜与吡嗪酰胺、2,2-二氯乙酸类药物合用，乱不适宜应用其他吡嗪酰胺类药物的疗程之应用本品，因为会产生骨髓再生不良或白血细胞减少的可能。

23. 不宜与银紫霉素合用，因银紫霉素与本品中的 TMP 合用两者血药浓度均可升高，银紫霉素的升高使不良反应增多且加重，尤其是高铁血红蛋白血症的发生。

24. 避免与青霉素类药物合用，因为本品有可能干扰此类药物的杀菌作用。

25. 药物 / 实验室检测相互作用：当使用细菌二氧二硫还原酶作为培养基时，

复方磺胺甲噁唑，特别是甲氧苄啶部分可干扰通过竞争性结合蛋白技术（CBPA）测定的血清甲氧苄啶测定。然而，如果通过放射免疫测定（RIA）测量甲氧苄啶，则不发生干扰。磺胺甲噁唑和甲氧苄啶的存在也可能干扰吡嗪的碱性磷酸酶反应测定，导致超过正常值范围约 30%。

##### 【药物过量】

急性：与用药过量的症状有关或可能危及生命的复方磺胺甲噁唑单次服用剂量尚未报道。磺胺类药物过量的症状和体征包括：食欲不佳、腹痛、恶心、呕吐、头痛、头晕和神志不清。可能需要注意发热、血尿和结晶尿的发生。血清异常和黄疸可能是用药过量的潜在表现。急性过量服用甲氧苄啶的症状包括：恶心、呕吐、头痛、头晕、烦躁、精神混乱和骨髓抑制。

一般的治疗原则包括：停药后进行洗胃、催吐或大量饮水；尿量低且肾功能正常时可给予利尿剂。酸化尿液会增加肾脏对甲氧苄啶的清除。应监测患者的血细胞计数和电解质等生化指标。如果出现明显的血液异常或黄疸，应针对这些并发症进行适当治疗。在清除磺胺甲噁唑和甲氧苄啶方面，腹膜透析无效。血清透析有一定效果。

慢性：大剂量和 / 或长期使用复方磺胺甲噁唑可能导致骨髓抑制，表现为血小板减少、白细胞减少和 / 或巨红细胞性贫血。若出现骨髓抑制的迹象，应每天给予患者甲氧苄啶叶酸 5-15mg，直到造血功能恢复正常。

##### 【药理毒理】

本品为磺胺类抗菌药，是磺胺甲噁唑（SM2）与甲氧苄啶（TMP）的复方制剂，对非产酶金黄色葡萄球菌，化脓性链球菌，肺炎链球菌，大肠埃希菌，克雷白菌属，沙门菌属，变形杆菌属，摩氏杆菌属，志贺菌属等肠杆菌科细菌，淋球菌，链球菌属，流感嗜血杆菌均具有良好抗菌作用。尤其对大肠埃希菌、流感嗜血杆菌、金黄色葡萄球菌的抗菌作用较 SM2 单药明显增强。此外在体外对沙眼衣原体、生殖支原体、弓形虫等亦具良好抗菌生物活性。

本品作用机制为：SM2 作用于二氢叶酸合成酶，干扰合成叶酸的第一步，TMP 作用于叶酸合成代谢的第二步，选择性抑制还原酶从而阻断叶酸的合成。二者合用可使细菌的叶酸代谢受到双重阻断。本品的协同抗菌作用较单药增强，对其呈现耐药菌株减少。然而近年来细菌对本品的耐药性亦呈增高趋势。

##### 【毒理研究】

生殖毒性：在大鼠中，经口给予 533mg/kg 磺胺甲噁唑或 200mg/kg 甲氧苄啶均可见致畸作用，主要表现为胎儿以体表面积计，这些致畸药为人每日推荐剂量的 5 和 6 倍。在两项大鼠研究中，512mg/kg 的磺胺甲噁唑与 200mg/kg 的甲氧苄啶合用未见致畸作用。在一些兔研究中，胎仔缺失 / 死胎和胎前吸收率 / 的胎增加与甲氧苄啶有相关性，以体表面积计，后者是人治疗剂量的 6 倍。

##### 【药代动力学】

本品口服后迅速吸收。磺胺甲噁唑和甲氧苄啶均以未结合、蛋白结合和代谢物形式存在于血液中；磺胺甲噁唑也以具原形形式存在。磺胺甲噁唑在人体内至少代谢为 5 种代谢物：N4-乙酰-N4-羟基-5-甲氧苄基-N4-乙酰-5-甲氧苄基-磺胺甲噁唑代谢物和 N-葡萄糖苷结合物。N4-羟基代谢物的形成是通过 CYP2C9 介导的。

甲氧苄啶在体外代谢为 11 种不同的代谢产物，其中 5 种为谷胱甘肽结合物，6 种为氧化代谢物，包括主要代谢物 1 和 3。氧化代谢物以 3 和 4 羟基衍生物。

磺胺甲噁唑和甲氧苄啶的游离形式被认为是具有治疗活性的形式。体外研究表明，甲氧苄啶是 P-糖蛋白、OCT1 和 OCT2 的底物，而磺胺甲噁唑不是 P-糖蛋白的底物。

大约 70% 的磺胺甲噁唑和 44% 的甲氧苄啶与血浆蛋白结合。血浆中 10% 磺胺甲噁唑的存在使甲氧苄啶的蛋白结合降低不明显；甲氧苄啶不影响磺胺甲噁唑的蛋白结合。

个别成分的血药浓度峰值出现在口服 1~4 小时后。磺胺甲噁唑和甲氧苄啶的平均半衰期分别为 10 小时和 8~10 小时。然而，肾功能严重受损的患者两种成分的平均半衰期均有所增加。需要调整给药方案。给药 24 小时后血液中可检测到大量的磺胺甲噁唑和甲氧苄啶。给予磺胺甲噁唑 100mg 和甲氧苄啶 160mg，每日两次，甲氧苄啶的平均稳态血药浓度是 1.72 μg/ml，稳态平均高于血清水平的自由和磺胺甲噁唑总浓度分别为 57.4 μg/ml 和 68.0 μg/ml。这些用药 5 天后达到稳定水平。磺胺甲噁唑和甲氧苄啶的排泄主要通过肾脏通过肾小球滤过和肾小管排泄。磺胺甲噁唑和甲氧苄啶的血药浓度均明显高于血清中的浓度。单次口服磺胺甲噁唑和甲氧苄啶后 0~72 小时内回收的平均排泄百分比总累积为 84.5%，游离甲氧苄啶为 66.8%。总磺胺的 30% 以游离磺胺甲噁唑排出体外，其余为 N4-乙酰化代谢物。当同时使用磺胺甲噁唑和甲氧苄啶时，磺胺甲噁唑和甲氧苄啶均不影响彼此的排泄模式。

磺胺甲噁唑和甲氧苄啶均分布于唾液、泪液和汗液中；甲氧苄啶也分布于支气管分泌物中，均能通过胎盘屏障，通过乳汁排泄。

老年药代动力学：研究了磺胺甲噁唑 800mg 和甲氧苄啶 160mg 在 6 名老年受试者（平均年龄 78.6 岁）和 6 名年轻健康受试者（平均年龄 28.3 岁）体内的药代动力学。老年受试者磺胺甲噁唑的药代动力学参数与年轻受试者相似。与年轻人 410 ml/h/kg 对比 59 ml/h/kg 相比，老年受试者的平均清除率明显较低。然而，体重校正后，老年受试者甲氧苄啶的表现总清除率平均比青年受试者低 19%。

##### 【贮藏】

遮光，密封保存。

##### 【包装】

口服固体药用高密度聚乙烯瓶：100 片 / 瓶。

口服固体药用片剂和药用铝箔：12 片 / 盒，12 片 / 板 × 2 板 / 盒，12 片 / 板 × 3 板 / 盒，12 片 / 板 × 4 板 / 盒。

【有效期】口服固体药用高密度聚乙烯瓶：36 个月

口服固体药用片剂和药用铝箔：24 个月

【执行标准】国家药品监督管理局药品注册标准编号 Y0114492021

【批准文号】国药准字 H37020649

【药品上市许可持有人】

名称：山东新华制药股份有限公司

注册地址：淄博市高新技术产业开发区开发路 1 号

邮政编码：258000

电话号码：0533-2166666

传真号码：0533-2184891

【生产企业】

企业名称：山东新华制药股份有限公司

生产地址：山东省淄博市张店区东一路 14 号

邮政编码：258005

电话号码：0533-2196361

传真号码：0533-2196365

网址：www.shxy.com

2021010111

 山东新华制药股份有限公司  
SHANDONG XINHUA PHARMACEUTICAL CO., LTD.

