



本PDF文件由 爱化学 ichemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[61036-64-4](#), 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.ichemistry.cn](#)

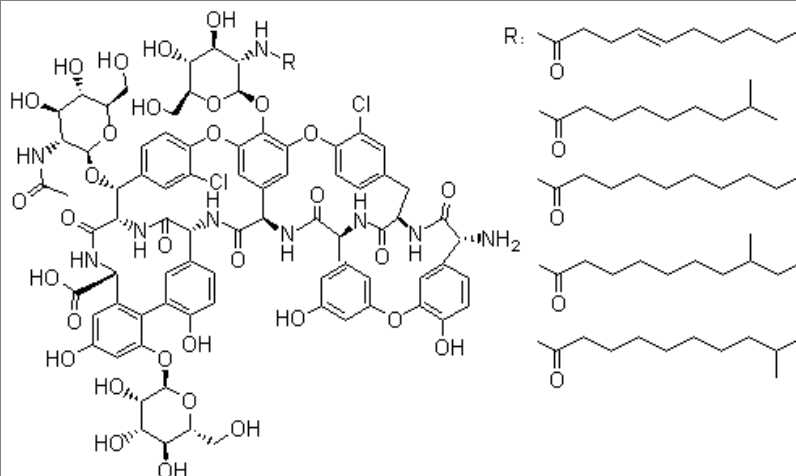
CAS Number:61036-64-4 基本信息

中文名: 替考拉宁A2

英文名: Teicoplanin A2

别名: teicoplaninA2; teichomyciti A2; MDL-507; targocid; targosid

分子结构:



分子式: $C_{78}H_{78}Cl_2N_9O_{32}R$

CAS登录号: 61036-64-4

EINECS登录号: None

CAS#61036-64-4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. 61036-64-4](#) 查看
若您是此化学品供应商, 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:

替考拉宁 (61036-64-4) 用于革兰阳性菌引起的各种感染。为糖肽类抗生素, 结构和万古霉素相似, 作用范围相仿。可抑制革兰阳性需氧菌或厌氧菌, 并具有杀菌作用。耐受性好, 毒性较低, 对肾功能无损。

生产方法及其他:

替考拉宁 (61036-64-4) 的制备方法:

- 由 *Actinoplans teichomyceticus novosp.* (ATCC31121) 产生的糖肽抗生素复合物, 可分为TA₁和TA₂, 其中TA₂又可分离为TA₂₋₁~TA₂₋₅五种成分。采用的培养基是葡萄糖、棉籽饼粉、麦芽提取物、酵母膏等, 进行常规发酵, 发酵单位为900U/mL。按下法得到的粗品可用柱层析来精制, 用Sephadex LH柱层析, 洗脱液: [丙酮](#)了[醋酸](#)乙酯-2mol/L[氨水](#) (10: 7: 7)。
- 各个组分的分离。10g T-A₂溶于1L 0.2%[甲酸铵](#)-[乙腈](#) (9: 1) 的混合液中, 用1mol/L[氢氧化钠](#)调至pH=7.5。将该溶液通过装有500g[硅烷化](#)的硅胶柱子, 然后用总共10L、含10%乙腈逐渐到含20%乙腈的0.2%[甲酸铵](#)溶液来洗脱。将有相似HPLC谱图的组分合并, 减压蒸出有机溶剂。剩余的[水](#)溶液通过装有10g硅烷化硅胶的柱子, 用蒸馏水将甲酸铵洗脱, 然后用50%乙腈水溶液洗脱。流出液浓缩至小体积, 在浓缩中可加些[丁醇](#)使水容易蒸出。往浓缩液中加入1: 1的[丙酮](#)-[乙醚](#)混合液, 使产生沉淀。如此可得到410mg的纯T-A₂₋₁和770mg的纯T-A₂₋₂。
- 而T-A₂₋₃以和T-A₂₋₂ (1: 1) 的混合物的形式得到, 用HPLC的半制备柱来提纯, 条件如下: 用Whatman Partisil ODS M9 10/50柱子; 流动相为0.2%甲酸铵水溶液-乙腈 (76: 24); 流速为4.5mL/min; 254nm紫外检测; 20mg试样溶

于1mL流动相。含纯T-A₂-2和T-A₂-3的流出液分别合并，和上述方法相似去盐和沉淀，得510mg纯T-A₂-2和520mg纯T-A₂-3。以按此同样的方式分离从第1次层析中得到的约1gT-A₂-4和T-A₂-5（1：1）的混合物，得350mg纯T-A₂-4和300mg纯T-A₂-5。

替考拉宁（61036-64-4）的药理毒理：

本品的活性成份是替考拉宁，一种新型糖肽类抗生素。本品抑制细胞壁合成的途径与万古霉素一样，干扰肽聚糖中新的部分的合成过程。本品通过肽聚糖亚单位中的氨基酸-D-丙氨酰-D-丙氨酸部分结合而起效应，这种结合将正常可被细菌细胞的延长和交叉一桥酸识别的部位“隐藏”起来。这种结合抑制两个方面：形成细胞壁链的亚单位的生长或延长，将新建连接到细胞壁的最终穿越一桥步骤。因此，细胞壁的整合和牢固遭到损坏，细胞生长停止，细胞最后死亡。抗菌谱：本品对厌氧的及需氧的革兰阳性菌均有抗菌活性。敏感菌有金黄色葡萄球菌和凝固酶阴性葡萄球菌（包括对甲氧西林敏感及耐药菌），链球菌，肠球菌，单核细胞增多性李斯特菌，细球菌，JK组棒状杆菌和革兰阳性厌氧菌，后者包括难辨梭状芽孢杆菌和消化球菌。其活性谱范围同万古霉素相似。由于替考拉宁独特的作用机制，很少出现耐替考拉宁的菌株。所以对青霉素类及头孢菌素类，大环内酯类，四环素和氨基糖苷类和利福平耐药的革兰阳性菌，仍对替考拉宁敏感。

替考拉宁（61036-64-4）的药代动力学：

吸收：替考拉宁在口服时是不会被吸收的。在肌注后的生物利用度为94%。分布（血清浓度）：对人静注后其血清浓度显示出两相的分布（一相快速的分布紧接着是一相比较慢的分布），其半衰期分别为0.3和3小时左右。该相分布跟随一个缓慢的排泄，其半衰期为70~100小时。单剂量：给予健康者每12小时400mg30分钟静注，连续5天后，第一次和第二次静注后的血清残留浓度平均分别为5.6±0.7 mg和9.4±1.5mg/l。继续静注后的第12个小时的血清浓度均超过10 mg/l。给予中性粒细胞减少的患者第一次的治疗是每12个小时静注400 mg；第二次静注后24小时后的残留浓度为10.8±5.7 mg/l。给予健康者6次肌注，每次200 mg，首三次肌注间隔12小时，随后三次为每24小时一次，最后一次肌注后的24小时，其残留浓度为6.1 mg/l。血清蛋白结合：与白蛋白的结合为90~95%。组织扩散：在稳态期时，明显的分布量变化为0.6至1.2l/kg。注射放射标记替考拉宁后，分布很迅速地在组织（尤其是皮肤和骨）起作用。随后在肾、支气管、肺和肾上腺达到很高的浓度。替考拉宁似乎可以进入白细胞及提高其抗菌活性。替考拉宁不进入红细胞，脑脊液和脂肪。单剂量给予人400静注后，其组织浓度为：松质骨：注射0.5和24小时后的浓度分别为10.8 μg/g和7.1 μg/g。密质骨：注射0.5和24小时后的浓度分别为6.1 μg/g和4.9 μg/g。发炎滑液：注射6处24小时后的浓度分别为4和1.4mg/l。肺组织：注射30和60分钟后的浓度分别为7.9和4.5 μg/g。胸膜液：注射6小时后达到高峰，其平均浓度为2.8mg/l。腹膜液：注射的一个小时后浓度就达到27.9mg/l。生物转化：无任何替考拉宁代谢产物被鉴别出来。超过80%所给予的量在16天内原型从尿液中排出。排出：-肾功能正常的患者：几乎全部所给予的替考拉宁量原型从尿液中排出。最终排除半衰期为70至100小时。肾功能不全的患者：替考拉宁的排除要比肾功能正常的患者慢。它存在着一个最终排除半衰期和肌酐清除率的相关性：老年人：替考拉宁排除的改变只不过是和年龄相关的肾功能衰退的一种反映。

替考拉宁（61036-64-4）的功能主治/适应症：

本品可用于治疗各种严重的革兰阳性菌感染，包括不能用青霉素类和头孢菌素类其他抗生素者。本品可用于不能用青霉素类及头孢菌素类抗生素治疗或用上述抗生素治疗失败的产生葡萄球菌感染，或对其他抗生素耐药的葡萄球菌感染。已证明替考拉宁对下列感染有效：皮肤和软组织感染，泌尿道感染，呼吸道感染，骨和关节感染，败血症，心内膜炎及持续不卧床腹膜透析相关性腹膜炎。在矫形手术具有革兰阳性菌感染的高危因素时，本品也可作预防用。

替考拉宁（61036-64-4）的用法用量：

本品既可以静脉注射也可以肌肉注射。可以快速静脉注射，注射时间为3~5分钟之间，或缓慢静脉滴注，滴注时间不少于30分钟。一般每日给药一次，但第一天可以给药两次。对敏感菌所致感染的大多数病人，给药后48~72小时会出现疗效反应，疗程长短则依据感染的类型、严重程度和病人的临床反应而定。心内膜炎和骨髓炎的疗程则推荐为3周或更长时间。严重感染和中性粒细胞减少的患儿，推荐剂量为10mg/kg，前三剂负荷剂量每12小时静脉注射一次，随后剂量为10mg/kg，静脉或肌肉注射，每天一次。对中度感染，推荐剂量为10mg/kg，前三剂负荷剂量每12小时静脉注射一次，随后维持剂量为6mg/kg，静脉或肌肉注射，每天一次。小于2个月的婴儿：婴儿第一天的推荐剂量为16mg/kg，只用一剂，随后8mg/kg，每天一次。静脉滴注时间不少于30分钟。

药物相互作用：

除非有肾损害，否则老年患者无需调整剂量，参见用法用量。

不良反应：

人们对他格适耐受性良好，不良反应一般轻微且短暂，很少需要中断治疗，严重不良反应罕见，已报道主要有以下不良反应：局部反应：红斑、局部疼痛、血栓性静脉炎，可能会引起肌肉注射部分脓肿。变态反应：皮疹、瘙痒、发热、僵直、支气管痉挛、过敏反应、过敏性休克荨麻疹、血管神经性水肿，极少报告发生剥脱性皮炎、中毒性表皮溶解坏死、多形性红斑、包括Stevens-johnson综合症。另外，罕有报道在先前无替考拉宁暴露史者输注时可发生输液相关事件，如红斑或上身潮红。这类事件在降低输液速率和/或降低胃肠道症状：恶心、呕吐、腹泻。血液学：觉可逆的粒细胞缺乏、白细胞减少、中性粒细胞减少、血小板减少、嗜酸粒细胞增多。肝功能：血清转氨酶和/或血清碱性磷酸酶增高。肾功能：血清肌酐升高，肾衰。中枢神经系统：头晕、头痛、心室内注射时癫痫发作。听觉及前庭功能：听力丧失，耳鸣和前庭功能紊乱。其他：二重感染（不敏感菌生长过度）

禁忌：对替考拉宁有过敏史者不可能使用本品。

妇女用药：孕妇和哺乳期妇女用药，虽然动物生殖实验并未显示本品有致畸作用。除非医生认为虽有危险仍非用不可，本品不应用于已确证妊娠或可能妊娠的妇女。目前尚无资料证实本品由乳法排出或进入胎盘。

儿童用药：2月以上儿童革兰阳性菌感染可用替考拉宁治疗。

老年用药：除非有肾损害，否则老年患者无需调整剂量，参见用法用量。

替考拉宁（61036-64-4）的注意事项：

他格适与万古霉素可能有交叉过敏反应，故对万古霉素过敏者慎用。但用万古霉素曾发生“红人综合征”者非本品禁忌征。以前曾报告用过替考拉宁引起血小板减少，特别是那些投区高于常用药量者建议治疗期间进行血液检查两次，并进行肝功能和肾功能的检测。曾有替考拉宁关于听力、血液学、肝和肾毒性方面的报告。应当对听力、血液学、肝和肾功能进行检测，特别是肾功能不全，接受长期治疗的，以及用本品期间同时和相继使用可能有听神经毒性和/或肾毒性的其他药物，如氨基糖苷类，多粘菌素，二性霉素B，环孢菌素，顺铂，呋塞米和依他尼酸。然而，上述药物与本品联合应用时，并未证实有协同毒性。肾功能受损者应调整剂量（参见剂量）。使用替考拉宁，特别是长期使用，在与其他抗生素联合使用时，可能会导致不敏感菌的过度生长，再生考虑患者病怀的需要是很必要的。如果在治疗期间发生二重感染，应进行适当的调整。

相关化学品信息

[612065-19-7](#) [61788-32-7](#) [61497-47-0](#) [磷酸二异辛酯与2-乙基-1-己胺的化合物](#) [4-硝基邻苯二甲酸二甲酯](#) [邻氯氟苯](#) [618-22-4](#) [氯氰碘柳胺钠](#) [61141-94-4](#) [3,4-二乙氧基苯乙胺](#) [61976-30-5](#) [61263-49-8](#) [61308-51-8](#) [61885-54-9](#) [3-氨基-4-氯苯甲酸十二烷酯](#) 436

生成时间2021/1/22 4:07:35