

替考拉宁 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/311/2021\\_2022\\_\\_E6\\_9B\\_BF\\_E8\\_80\\_83\\_E6\\_8B\\_89\\_E5\\_c22\\_311472.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/311/2021_2022__E6_9B_BF_E8_80_83_E6_8B_89_E5_c22_311472.htm) 药品名称替考拉宁 药物别名肽可霉素，壁霉素、他格适 英文名称Teicoplanin 类别中药制剂粉针剂：0.2g、0.4g。分子式成分替考拉宁的分子式为A<sub>2</sub>-2，C<sub>88</sub>H<sub>97</sub>C<sub>12</sub>N<sub>9</sub>O<sub>33</sub>。药理及应用吸收：替考拉宁口服不吸收，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。单剂量给予健康人静注3或6 mg/kg，5分钟后，其血清浓度分别为53.4和111.8 mg/L。24小时后血清残留浓度分别为2.1和4.2 mg/L。重复剂量：给予健康者每12个小时400 mg，30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 ± 0.7mg/L和9.4 ± 1.5 mg/L。继续静注后的第12个小时的血清浓度均超过10 mg/L。给予中粒细胞减少的患者每12个小时静注400 mg，第二次静注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3次肌注间隔12小时，随后3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0.6-1.2 L/kg。注射放射标记的替考拉宁后，迅速地分布到各组织（尤其是皮肤和骨），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 mg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  $\mu\text{g/g}$ 和7.1  $\mu\text{g/g}$ 。密质骨 - 注射0.5和24小时后的浓度分别为6.1  $\mu\text{g/g}$ 和4.9  $\mu\text{g/g}$ 。发炎滑液 - 注射6和24小时后的浓度分别为4和1.4  $\text{mg/L}$ 。肺组织 - 注射30和60分钟后的浓度分别为7.9和4.5  $\mu\text{g/g}$ 。胸膜液 - 注射6小时后达到高峰，其平均浓度为2.8  $\text{mg/L}$ 。腹膜液 - 注射的1小时后浓度就达到27.9  $\text{mg/L}$ 。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天内以原型从尿液中排出。排出：肾功能正常的患者：几乎全部所给予的替考拉宁量以原型从尿液中排出。最终排除半减期为70-100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减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。微生物学 替考拉宁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、单核细胞增多性李司特菌，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。药理毒理本品为与万古霉素类似的新糖肽抗生素，其抗菌谱及抗菌活性与万古霉素相似。对金葡菌的作用比万古霉素更强，不良反应更少。本品对革兰阳性菌如葡萄球菌、链球菌、肠球菌和大多厌氧性阳性菌敏感。药效学 替考拉宁为一种新型糖肽类非肠道给药抗生素，具有强的杀菌活性。可供天天一次静脉或肌肉注射。本药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。本药通过与肽聚糖亚单位中的氨基酰-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链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损坏，细胞生长停止，细胞最后死亡。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、四环素和氯霉素，氨基糖苷类和利福平耐药的革兰氏阳性菌，仍对替考拉宁敏感。药动学本品口服不吸收。肌肉注射T<sub>max</sub>约2h。PB约90%。几乎全由肾脏排泄，肾功能正常成年人T<sub>1/2</sub>约45h~60h，肾功能障碍时延长，无尿患者可长达163h。适应症耐青霉素、头孢菌素菌及青霉素过敏的革兰阳性菌感染。不良反应可引起注射处持久的疼痛。亦具有耳毒性。人们对本药耐受性良好，不良反应一般稍微且短暂，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。变态反应：皮疹、瘙痒、发热、支气管痉挛、过敏反应。胃肠道症状：恶心、呕吐、腹泻。血液学：嗜酸粒细胞增多、白细胞减少、中粒性细胞减少、血小板减少、血小板增多。肝功能：血清转氨酶和/或血清碱性磷酸酶增高。肾功能：血清肌酐短暂升高。中枢神经系统：头晕、头痛。其他虽已报道，但尚未明确与本药是否有关的不良反应有：轻度听力下降，耳鸣和前庭功能紊乱。相互作用临床实践中，本药常与其他类药物同时使用，包括其他抗生素、降压药、麻醉剂、心脏病药、降糖药等，但未发现有不良的交叉反应。用法用量静脉注射或滴注：成人，每日6mg~7mg/kg，开始2次/日，后改为1次/日。肾功能正常的成人和老年人：矫形手术预防感染：麻醉诱导期单剂量静脉注

射400 mg。中度感染，如皮肤和软组织感染、泌尿系统感染、呼吸道感染：负荷量：第一天400 mg，静脉注射1次。维持量：静脉或肌肉注射200 mg，每日1次。严重感染，如骨和关节感染、败血症、心内膜炎：负荷量：静脉注射400 mg，每12小时给药1次，连续3次。维持量：静脉或肌肉注射400 mg，每日1次。某些临床情况，如严重烧伤感染或金黄色葡萄球菌心内膜炎病人，替考拉宁维持量可能需要达到12 mg/kg。儿童用药：2月以上儿童革兰氏阳性菌感染：严重感染和中性粒细胞减少的患儿，推荐剂量为10 mg/kg，前三剂量每12小时静脉注射一次，随后剂量为10 mg/kg，静脉或肌肉注射，天天1次。对中度感染，推荐剂量为10 mg/kg，前三剂量每12小时静脉注射1次，随后剂量为6 mg/kg，静脉或肌肉注射，天天1次。新生儿：负荷量为第一天16 mg/kg，只用一剂，随后几天保持8 mg/kg，天天1次，静脉滴注时间不少于30分钟。肾功能不全的成人和老年人：肾功能受损患者，前3天仍然按常规剂量，第4天开始根据血药浓度的测定结果调节治疗用量。疗程第4天的用量：轻度肾功能不全者（肌酐清除率在40-60 mL/分），剂量减半，方法是按常规剂量，隔天1次；或剂量减半，天天1次。严重肾功能不全（肌酐清除率少于40 mL/分或血液透析者），剂量为常规剂量的三分之一。按常规剂量给药，每三天1次；或按常规剂量三分之一给药，天天1次。本品不能被血透清除。持续不卧床腹膜透析者：发热病人，第一次负荷剂量400 mg静脉给药，然后推荐在第1周每袋透析液袋中按20 mg/L的剂量给药，第3周仅在夜间的透析液袋内按20 mg/L的剂量给药。本品200 mg及400 mg标准剂量分别相当于3 mg/kg及6 mg/kg平均剂量，如病人体重超

过85 kg，建议用相同治疗方案按公斤体重给药：中度感染为3 mg/kg，严重感染为6 mg/kg。本药可以静脉注射也可以肌肉注射，快速静脉注射时间不少于1分钟，缓慢静脉滴注时间不少于30分钟。一般每日给药1次，但第一天可以给药2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。

**用药过量** 药物过量的治疗是对症治疗，有报道2例中性粒细胞减少的儿童（年龄分别为4岁和8岁），因用药不慎，几次过量使用本品，剂量高达100 mg/kg/天，尽管替考拉宁血药浓度高达300 mg/L，但未出现临床症状和实验室检查值异常。替考拉宁不能被血透清除。

**用药须知** 配制本药时，应慢慢将全部注射用水注入小瓶中，大约有0.2 mL水将会留在注射器中。用双手轻轻滚动小瓶直至药粉完成溶解，注重避免发生泡沫。要保证所有药粉，非凡是瓶塞四周的药粉都完全溶解。然后慢慢从小瓶中抽出替考拉宁溶液，为了吸取更多的溶液，要将注射针头插在瓶塞中心。如此制备的替考拉宁注射液浓度应为100 mg/1.5 mL (200 mg药瓶) 和400 mg/3 mL (400 mg药瓶)。振摇会产生泡沫，以至不能获得足够的药液，然而假如替考拉宁完全溶解，泡沫不会改变100 mg/1.5 mL (200 mg药瓶) 和400 mg/3 mL (400 mg药瓶)的药液浓度。假如出现泡沫，可将溶液静置15分钟，待其消泡。非常重要是要正确的配制溶液并用注射器小心抽出，配置方法不当将会导致给药剂量低于50%。配制好的溶液为pH 7.5的等渗液，可直接注射，也可用下述溶剂稀释药粉：0.9%氯化钠注射液，复方乳酸钠溶液（林格氏-乳酸溶液，哈特曼氏溶液），5%葡萄糖

溶液，0.18%氯化钠和4%葡萄糖注射液，含1.36%或3.86%葡萄糖的腹膜透析液。替考拉宁和氨基糖苷类两种溶液直接混合是不相容的，因此注射前不能混合。制备好的本药溶液应立即使用，未用完部分应丢弃。少数情况下配制好不能立即使用，则将制备好的本药溶液在4℃以下保存，但不得超过24小时。注重事项对替考拉宁有过敏史者禁用。妊娠及哺乳期妇女、小儿、严重肾功能不全患者慎用。一般腹膜透析和血液透析不影响本品的排出。本药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症。以前曾报告过用替考拉宁引起血小板减少，非凡是那些给药量高于常规用药量者，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。下述情况需监测肾功能和听力：肾功能不全者长期用本药治疗，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，两性霉素B，环孢菌素，顺铂，呋塞米和依他尼酸。然而，上述药物与本药联合应用时，并未证实有协同毒性。监测替考拉宁血药浓度可使治疗更完善，治疗严重感染时，本品血药浓度不应小于10 mg/L。孕妇和哺乳期间用药：虽然动物生殖实验并未显示本药有致畸作用，除非认为虽有危险仍非用不可，本药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药由乳汁排出或进入胎盘。

100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 [www.100test.com](http://www.100test.com)