

当前位置: 科技频道首页 >> 新药研发 >> 化学药 >> 半合成抗菌素-氧哌嗪青霉素

请输入查询关键词

科技频道

搜索

半合成抗菌素-氧哌嗪青霉素

关键词: 氧哌嗪青霉素 半合成青霉素 抗菌素 合成 有机合成

所属年份: 2002

成果类型: 应用技术

所处阶段:

成果体现形式:

知识产权形式:

项目合作方式:

成果完成单位: 上海第三制药厂

成果摘要:

氧哌嗪青霉素(Piperacillin)是日本研究成功的第三代半合成青霉素,其抗菌谱广,对革兰氏阳性菌、阴性菌,包括绿脓杆菌、肠杆菌、沙雷氏菌等致病菌均有较强的抗菌活性。对耐庆大霉素和羧苄青霉素的绿脓杆菌也有效,血药浓度高,组织分布均匀,与丙磺舒及氨基糖甙类抗生素有协同作用。上海第三制药厂从1978年开始进行试制,研究成功了以 β -羟乙胺为起始原料,经过溴化、胺化、环合羟氧酰化制造侧链EPCP的合成工艺。将EPCP与6-APA缩合得到氧哌嗪青霉素,经过理化分析证实其结构与国外文献报导完全一致。该工艺各步收率稳定,原材料立足于国内,有成熟的三废处理方法,适合于工业生产。临床试验证明本品抗菌作用强于氨基青霉素、羟氨基青霉素和吡苄青霉素,特别是对革兰氏阴性菌的活性强。另外本品毒性低,小鼠静注、腹腔注射及皮下注射的LD₅₀分别为6050~6140、8900~11220及16730mg/kg。对呼吸道感染的有效率达80.77%,对尿道感染的有效率为81.2%,对皮肤软组织感染的有效率为88.89%,对感染症总有效率为77.7%。除个别病例有皮疹、皮肤瘙痒症状外无严重毒副作用,对肝、肾的损害也较小,可作为临床上抗感染药物的首选药。氧哌嗪青霉素的试制成功,不仅填补了我国半合成青霉素的一项空白,由于半合成青霉素在原料和工艺方面有许多共同之处,因此也推动了其它半合成青霉素的发展,为我国 β -内酰胺类抗生素的更新换代作出了贡献。鉴定意见:1.细菌对本品与羧苄青霉素和庆大霉素间无交叉耐药性,注射给药后迅速达到较高血浓度,并分布到肾、肝、肺、皮肤等各组织,同时以较高血浓度从胆汁及尿中排出,用于治疗敏感菌引起的各种感染,具有良好的疗效,毒性反应较低,也适用于肾、心、肝功能不全的患者。2.合成路线较为合理,原材料及各步中间体均有质量规格控制,产品质量符合药用要求,与国外样品对比一致。并经临床试用,疗效显著,建议有关部门尽快批准,组织生产,推广使用,以满足临床的需要。3.建议进一步加强对制造工艺及产品制剂的研究,提高产品收率与质量,降低成本,进一步改进三废处理的设施。4.建议在临床上进一步对败血症、心内膜炎等的治疗研究,总结与其它药物(如庆大霉素等)合用的临床经验,为推广使用提出较完整的治疗方案。

成果完成人:

完整信息

行业资讯

甾体活性化合物的研制及合成...
 醋酸祛炎舒松的工艺改进
 基因工程生长激素及生长因子...
 一种单甲氧基聚乙二醇-胰岛素...
 长效复方消炎磺注射液的研制
 磺基甜菜碱中型试验
 化学合成生产硫酸伪麻黄碱
 氨氯地平
 结合态孕马混合雌激素提取方法
 人绒毛膜促性腺激素(HCG)的纯...

成果交流

推荐成果

- 基于内源性物质的寡肽活性物... 04-17
- 中国独创的一类抗癌新药-铂... 04-17
- 靶向PKC-alpha mRNA的反义药... 04-17
- 维生素E的高效液相色谱分析法 04-17
- 稀有金属锆-有机酸系列化合物... 04-17
- 圈卷产色链霉菌变株 04-17

· (S)-异丝氨酸的合成	04-17
· 抗前列腺增生药物-非那甞胺的...	04-17
· 病毒抑制剂的设计合成及活性测定	04-17

Google提供的广告

>> 信息发布

[版权声明](#) | [关于我们](#) | [客户服务](#) | [联系我们](#) | [加盟合作](#) | [友情链接](#) | [站内导航](#) | [常见问题](#)
国家科技成果网

京ICP备07013945号