



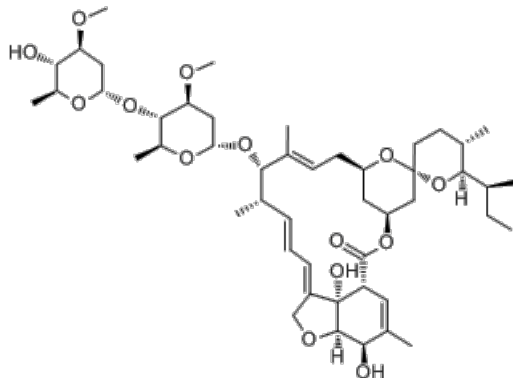
本PDF文件由 爱化学 iChemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[70288-86-7](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

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:70288-86-7 基本信息

中文名: 依维菌素
英文名: Ivermectin
别名: Ivomec;
Heartgard-30

分子结构:



分子式: $C_{48}H_{74}O_{14}$

CAS登录号: 70288-86-7

EINECS登录号: 274-536-0

物理化学性质

伊维菌素(70288-86-7)的性状:

1. 含至少80%的22, 23-dihydroavermectin B_{1a}和不多于20%的22, 23-dihydroavermectin B_{1b}。
2. 类白色粉末。[α]_D+71.5° ±3° (c=0.755, 氯仿)。
3. UV最大吸收(甲醇): 238nm, 245nm(ϵ 27100, 30100)。
4. 水中溶解度约4 μ g/mL。极易溶于甲基乙基酮、丙二醇或聚丙二醇, 不溶于饱和碳氢化物, 如环己烷。
5. B_{1a}: 从乙醇-水结晶, 熔点155~157°C。

安全信息

安全说明:
S26: 万一接触眼睛, 立即使用大量清水冲洗并送医诊治。
S36: 穿戴合适的防护服装。
S45: 出现意外或者感到不适, 立刻到医生那里寻求帮助(最好带去产品容器标签)。
S53: 避免暴露——使用前先阅读专门的说明。

危险类别码:
R22: 吞咽有害。
R25: 吞咽有毒。
R36: 刺激眼睛。
R61: 可能对未出生的婴儿导致伤害。
R36/38: 对眼睛和皮肤有刺激作用。

CAS#70288-86-7化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

Sigma-Aldrich 专业从事70288-86-7及其他化工产品的生产销售 800-736-3690

供应商信息已更新且供应商的链接失效, 请登录爱化学 [CAS No. 70288-86-7 查看](#)

若您在此化学品供应商, 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: 抗寄生虫病药。

1. 伊维菌素(70288-86-7)的规格:

为 $B_{1a}(C_{48}H_{74}O_{14})$ 和 $B_{1b}(C_{47}H_{72}O_{14})$ 的混合物;按无水、无溶剂计算,含不少于90.0%的 $B_{1a}(C_{48}H_{74}O_{14})$, B_{1a} 和 B_{1b} 的总量不得少于95.0%和不得大于100.5%; $[\alpha]_D^{20} -17^{\circ} \sim -20^{\circ}$ (0.250g本品溶于50.0mL甲醇);有关物质应符合规定;乙醇和甲酰胺的含量不得大于5.0%;含重金属不得大于0.002%;含水分不得大于1.0%;硫酸盐灰分不得大于0.1%。

2. 伊维菌素(70288-86-7)的生产方法:

由相应的不饱和化合物在苯中,三(三苯基膦)铑氯化物催化下,在室温下常压氢化而得。

3. 介绍:

该药是由阿维链霉菌(streptomyces avermitilis)发酵产生的半合成大环内酯类多组分抗生素。主要含伊维菌素 $B_1(B_{1a}+B_{1b})$ 不低于93%,其中 B_{1a} 不得少于85%。

伊维菌素 B_1 即22,23-双氢阿维菌素 B_1 。

4. 药理:

(1) 药效学:

该药是新型的广谱、高效、低毒抗生素类抗寄生虫药,对体内外寄生虫特别是线虫和节肢动物均有良好驱杀作用。但对绦虫、吸虫及原生动物的无效。

大环内酯类抗寄生虫药对线虫及节肢动物的驱杀作用,在于增加虫体的抑制性递质 γ -氨基丁酸(GABA)的释放,以及打开谷氨酸控制的 Cl 离子通道,增强神经膜对 Cl 的通透性,从而阻断神经信号的传递,最终神经麻痹,使肌肉细胞失去收缩能力,而导致虫体死亡。

由于吸虫和绦虫不以GABA为传递递质,并且缺少受谷氨酸控制的 C_1 通道。故本类药物对其无效。哺乳动物的外周神经递质为乙酰胆碱,GABA虽分布于中枢神经系统,但由于本类药物不易透过血脑屏障,而对其影响极小,因此使用时就比较安全。

本类药物影响寄生虫生殖的机理还不太清楚,但能使雌减少产卵,反刍兽线虫虫卵形态异常和使丝状线虫(雄、雌性)不育。

(2) 药动学:

该药的药代动力学因畜种、剂型和给药途径不同而有明显差异。以血浆半衰期为例,给牛、绵羊静脉注射 $300\mu g/kg$ 量, $t_{1/2}$ 虽然差别不大(分别为2.8天和2.7天),但羊的血浆浓度较低是由于表观分布容积大于牛所致。该药在犬体内排泄较快($t_{1/2}=1.6\sim 1.8$ 天)。猪的半衰期长达4天。

用美国专用的商品制剂给牛皮下注射($200\mu g/kg$),由于从注射局部缓慢吸收,而半衰期延长($t_{1/2}=8$ 天),48h血药达峰值,据临床驱虫效果观察,药效能维持2周。绵羊内服后的半衰期为3~5天,24h后达血药峰值。

犬内服($100\mu g/kg$)片剂,2~4h内血药达峰值($40ng/mL$)。猪血药峰值到达时间,内服(0.5天)比皮下注射(2天)快,但皮下注射的生物利用度比内服要高得多,通常内服时的生物利用度仅为注射法的41%。

两种不同剂型(糊剂和水性微胞专用剂型)的该药给马内服,血药峰值出现时间,不仅水性微胞制剂(4~5h)比糊剂(15h)快得多,而且生物利用度亦高。(糊剂仅为水性微胞剂的20%)。

吸收后该药广泛分布于全身组织,并以肝脏和脂肪组织中浓度最高。该药通常在肝脏中氧化成代谢产物。

该药在5~6天内经粪便排泄的占90%以上,经尿排泄仅占0.5%~2%。

5. 用途:

该药广泛用于牛、羊、马、猪的胃肠道线虫、肺线虫和寄生节肢动物,犬的肠道线虫,耳螨、疥螨、心丝虫和微丝蚴,以及家禽胃肠线虫和体外寄生虫。

(1) 牛、羊: 该药按 $0.2mg/kg$ 量给牛、羊内服或皮下注射,对血矛线虫、奥斯特线虫、古柏线虫、毛圆线虫(包括艾氏毛圆线虫)、圆形线虫、仰口线虫、细颈线虫、毛首线虫、食道口线虫、网尾线虫以及绵羊夏伯特线虫成虫及第4期幼虫、驱虫率97%~100%。上述剂量对节肢动物亦很有效:如蝇蛆(牛皮蝇、纹皮蝇、羊狂蝇)、螨(牛疥螨、羊痒螨)和虱(牛腭虱、牛血虱和绵羊腭虱)等。该药对嚼虱(毛虱属)和绵羊羊蝇蝇疗效稍差。

该药对蝇以及粪便中繁殖的蝇也极有效,药物虽不能立即使蝇死亡或肢解,但能影响摄食、蜕皮和产卵,从而降低生殖能力。一次给动物皮下注射 $0.2mg/kg$ 或每天喂低浓度($0.01mg/kg$)药物后5天时,蝇出现上述现象最为明显。按 $0.2mg/kg$ 剂量一次皮下注射对在粪便中繁殖的蝇也有一定的控制作用,牛用药9天后其粪便中面蝇、秋家蝇幼虫不能发育成虫,再过5天,由于蛹的畸形和成虫成熟过程受阻而使蝇的繁殖大为减少,对血蝇(扰血蝇)用上述剂量,4周后情况相似。

(2)马: 马内服0.2mg/kg该药对下列属大型和小型圆形线虫的成虫及第4期幼虫均有高效(95%~100%); 如大型圆形线虫(普通圆形线虫、马圆形线虫、无齿圆形线虫)、蛔虫(马副蛔虫)、蛲虫(马尖尾线虫)、胃虫(大口德拉西线虫、柔线属线虫)、小肠线虫(艾氏毛圆线虫、韦氏类圆线虫)、肺线虫(安氏网尾线虫)等。对移行或胃居留期的三种马胃蝇蛆, 引起皮肤损伤的盘尾丝虫微丝蚴以及胃线虫第三期幼虫, 虽然一次应用0.2mg/kg量也很有限, 但最佳方案是在一个月后按上述量再用药一次。

特别有重要意义的是, 该药推荐剂量(0.2mg/kg)对普通圆形线虫早期和第4期幼虫, 移行期造成的肠系膜动脉损害治疗的有效率约为99%, 通常用药2天后, 症状明显减轻, 约28天损害症状全部消失。

(3)猪: 肌内注射0.3mg/kg该药对猪具广谱驱虫活性。如猪蛔虫、红色猪圆线虫、兰氏类圆线虫、猪毛首线虫、食道口线虫、后圆线虫、有齿冠尾线虫成虫及未成熟虫体驱除率达94%~100%, 对肠道内旋毛虫(肌肉内无效)也极有效。上述用法对猪血虱和猪疥螨也有良好控制作用。

(4)犬、猫: 国外有专用剂型(按6~12 μ g/kg量)用于防治犬心丝虫微丝蚴感染, 我国可试用50 μ g/kg内服法治疗心丝虫微丝蚴虫感染(成虫无效)。临床试验证实, 高剂量该药对犬多种寄生虫有高效, 如一次皮下注射50 μ g/kg对犬钩口线虫、巴西钩口线虫、欧洲犬钩口线虫, 100 μ g/kg对犬鞭虫, 200 μ g/kg对犬弓首蛔虫成虫及第四期幼虫均有极佳驱只效果。对狮弓蛔虫, 按200 μ g/kg量, 皮下注射疗效仅69%, 而内服则达95%。本品一次皮下注射, 对犬寄生于肺部的嗜气毛细线虫(200 μ g/kg)、奥氏欧斯勒线虫(400 μ g/kg)也有极佳驱除效果。内服或皮下注射200 μ g/kg, 两周后再用一次, 对肠道粪类圆线虫(第3期幼虫除外)有效率95%~100%。

该药对犬、猫的某些节肢动物感染也有效, 犬、猫皮下注射200 μ g/kg剂量, 两周后再用一次能排除耳螨、疥螨、犬肺刺螨的感染。按300 μ g/kg量, 连用两次(间隔2周)对姬螯螨感染也很有效。治疗犬蠕形螨病最好按600 μ g/kg皮下注射量, 间隔7天, 连用5次。

(5)禽: 对家禽线虫如鸡蛔虫和封闭毛细线虫以及家禽寄生的节肢动物, 如膝螨(突变膝螨)等, 按200~300 μ g/kg量内服或皮下注射均有高效。但本品对鸡异刺线虫无效。

(6)驯鹿: 对驯鹿的牛皮蝇蛆(*Oedemagena tarandi*)感染, 按牛用量(200 μ g/kg)皮下注射即可。

6. 药物相互作用:

该药商品制剂中含有的不同佐剂能影响药物的作用, 如绵羊内服含吐温-80做佐剂的制剂, 该药用量达4000 μ g/kg时, 仍很安全, 但若以丙二醇做佐剂时则使绵羊持续3天出现共济失调和血红蛋白尿。美国含吐温-80做佐剂的依维菌素注射剂是马属动物专用商品制剂, 但不能用于犬, 否则亦极不安全。

7. 注意:

(1)该药虽较安全, 除内服外, 仅限于皮下注射, 因肌肉、静脉注射易引起中毒反应。每个皮下注射点, 亦不宜超过10毫升。

(2)含甘油缩甲醛和丙二醇的国产该药的注射剂, 仅适用于牛、羊、猪和驯鹿, 用于其他动物, 特别是犬和马时易引起严重局部反应。

(3)多数品种犬应用该药均较安全, 但有一种长毛牧羊犬(Collies)对本品敏感, 100 μ g/kg以上剂量即出现严重不良反应, 但60 μ g/kg量, 一月一次, 连用一年, 对预防心丝虫病仍安全有效。

(4)该药对线虫, 尤其是节肢动物产生的驱除作用缓慢, 有些虫种, 要数天甚至数周才能出现明显药效。

(5)该药对虾、龟及水生生物有剧毒, 残存药物的包装品切勿污染水源。

(6)阴雨、潮湿及严寒天气均影响0.5%该药浇泼剂的药效; 牛皮肤损害时(癣、疥螨)能使毒性增强。

(7)该药的注射剂的休药期, 牛35天, 羊42天, 产奶期禁用; 猪18天; 驯鹿56天; 食用马禁用。预混剂休药期, 猪5天。

8. 用法与用量:

(1)该药: 内服, 一次量, 每1kg体重; 家畜, 0.2~0.3mg。

(2)该药的注射液: 皮下注射, 一次量, 每1kg体重; 牛、羊0.2mg, 猪0.3mg。

(3)该药的浇泼剂: 背部浇泼, 每1kg体重; 牛、羊、猪0.5mg。

9. 制剂与规格:

该药的预混剂: 1000g: 6g。

该药的注射液:

(1)1mL: 0.01g(1万单位);

(2)2mL: 0.02g(2万单位);

(3)5mL: 0.05g(5万单位);

(4)50mL: 0.5g(50万单位);

生产方法及其他:

(5)100mL: 1.0g(100万单位)。

该药的浇泼剂250mL: 125mg。

10. 功能主治:

本品为阿维菌素的衍生物,属口服半合成的广谱抗寄生虫药。本品对各种生命周期的大部分线虫(但非所有线虫)均有作用;对盘尾丝虫的微丝蚴有效,但对成虫无效;对仅处于肠道的粪圆线虫也有效。本品具有选择性的抑制作用,通过与无脊椎动物神经细胞与肌肉细胞中谷氨酸为阀门的氯离子通道的高亲和力结合,从而导致细胞膜对氯离子通透性的增加,引起神经细胞或肌肉细胞超极化,使寄生虫麻痹或死亡。本品亦可与其它配体阀门(如神经递质 γ -氨基丁酸(GABA))的氯离子通道相互作用。本品的选择性是因为一些哺乳动物体内没有谷氨酸-氯离子通道,且阿维菌素对哺乳动物配体-氯离子通道仅有低亲和力。本品不能穿透人的血脑屏障。盘尾丝虫病和类圆线虫病及钩虫、蛔虫、鞭虫、蛲虫感染。

11. 用法用量:

类圆线虫病:推荐剂量是单剂量口服200 μ g/kg,用水送服。通常情况下无需加量,但需随访以保证根治。常用剂量如下:15-24kg者,剂量为半片(约3mg);25-34kg者,剂量为1片(约6mg);35-50kg者,剂量为1片半(约9mg);51-65kg者,剂量为2片(约12mg);66-79kg者,剂量为2片半(约15mg);大于80kg者,200 μ g/kg。

盘尾丝虫病:推荐剂量是单剂量口服150 μ g/kg,用水送服。常用剂量如下:15-24kg者,剂量为半片(约3mg);25-44kg者,剂量为1片(约6mg);45-64kg者,剂量为1片半(约9mg);65-84kg者,剂量为2片(约12mg);大于80kg者,150 μ g/kg。

钩虫感染:14岁以上者单次口服12mg(相当于0.2mg/kg);14岁以下者单次口服6mg。

蛔虫感染:14岁以上者单次口服6mg(相当于0.1mg/kg),14岁以下者单次口服3mg。

鞭虫感染:14岁以上者单次口服12mg(相当于0.2mg/kg);14岁以下者单次口服6mg。

蛲虫感染:14岁以上者单次口服12mg(相当于0.2mg/kg);14岁以下者单次口服6mg。

用药过量:症状 本品应按规定剂量使用。如过量使用,可能产生包括共济失调、呼吸缓慢、震颤、眼睑下垂、活动减少、呕吐及瞳孔散大。

处理:如发生药物过量,应尽快催吐及洗胃,如需要可再给导泻药及进行其它常规抗毒治疗。如发生意外中毒,可根据需要进行支持疗法(包括补充体液及电解质,氧气或进行机械性通气)。如出现临床明显低血压应给予升压药。

12. 不良反应:

超剂量可引起中毒,无特效解毒药。肌内注射会产生严重的局部反应。

13. 注意事项:

有关历史资料说明,抗丝虫药物[例如乙胺嗪枸橼酸盐(DEC-C)]可引起盘尾丝微丝幼虫病人皮肤和(或)全身严重的变态反应(Mazzotti反应)及眼科反应。这些反应可能是由于死亡的微丝幼尸体引起的过敏与炎症反应。用该药治疗盘尾丝微丝幼虫病人在临床上可能出现这些反应,也许或肯定与药物本身有关。

用杀微丝蚴药物治疗后,出现过敏性盘尾丝虫性皮炎的患者更易发生严重不良反应,尤其是水肿及盘尾丝虫性皮炎加剧致癌性、致突变性及生殖毒性。

类圆线虫病患者在使用本品时,必须重复进行粪检以确定类圆线虫感染已得到清除。

本品不能杀死盘尾丝虫成虫,因而采用本品治疗盘尾丝虫病时,需持续治疗。

免疫缺陷宿主的类圆线虫病:免疫缺陷(包括HIV感染)的病人可能需要重复治疗肠道类圆线虫病。对于这类病人尚没有进行临床试验以确定可供选择的剂量方案,抑制治疗(如每月一次)可能会有作用。

14. 存储:

远离热,明火和火花。存放在密封容器内,并放在阴凉,干燥处。储存的地方必须远离氧化剂。2-8 $^{\circ}$ C保存。

15. 其他:

①氢键供体数量:6;

②氢键受体数量:28;

③可旋转化学键数量:15;

④拓扑分子极性表面积(TPSA):340;

⑤重原子数量:123。

相关化学品信息

[70886-50-9](#) [7038-24-6](#) [709666-25-1](#) [700834-58-8](#) [701-56-4](#) [706805-01-8](#) [70303-40-1](#) [70028-75-0](#) [5-氯-3-\(N-乙酸甲酯-N-甲基氨基磺酰基\)-噻吩-2-甲酸甲酯](#) [1-\(3-氟苯基\)-2-硝基乙烯](#) [反式对异丙基环己基甲酸](#) [活性红24](#) [70553-39-8](#) [1-氯-2,4-二甲氧基苯](#) [7037-92-](#)

