



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: Dalbavancin Impurity - A40926

CAS 号: 102961-72-8

产品货号: S88251

生物活性:

Description	A40926 是一种靶向细菌细胞壁肽聚糖前体 D-丙氨酰-D-丙氨酸 (D-Ala-D-Ala) 的糖肽类抗生素。A40926 通过竞争性结合该靶点不可逆抑制细胞壁合成,对革兰氏阳性菌 (如葡萄球菌、链球菌) 及淋病奈瑟菌具高效杀菌活性, MIC=0.06-2 μ g/mL, 对青霉素耐药菌株亦有效。A40926 阻断肽聚糖交联, 破坏细胞壁完整性, 导致细菌裂解死亡。A40926 兼具脂溶性脂肪酸结构, 可提升血清浓度并延长作用时间 (如大鼠体内终端半衰期达 61.22 h)。	
IC50 & Target	Glycopeptide	
In Vitro	A40926 对革兰氏阳性菌 (如金黄色葡萄球菌、链球菌) 及淋病奈瑟菌表现出强效抑制活性, MIC=0.004-32 μ g/mL, 其中对淋病奈瑟菌临床分离株的 MIC 中位数为 1 μ g/mL, 显著低于 Teicoplanin 和 Vancomycin [1]。 A40926 (4-16 μ g/mL; 5 h) 在 4-8 倍 MIC 浓度下, 5 h 内可杀灭 99.9%-99.99% 的临床分离株, 包括青霉素耐药和 Spectinomycin 耐药菌株, 表现出快速杀菌活性[1]。 Cell Viability Assay[1]	
	Cell Line:	<i>Neisseria gonorrhoeae</i> , <i>Streptococcus pyogenes</i> , <i>Streptococcus faecalis</i> , <i>Staphylococcus aureus</i> , <i>Staphylococcus epidermidis</i>
	Concentration:	MIC
	Incubation Time:	
	Result:	Exhibited antibacterial activity with MIC values of 2 μ g/mL (<i>Neisseria gonorrhoeae</i>), 0.06 μ g/mL (<i>Streptococcus pyogenes</i>), 0.06 μ g/mL (<i>Streptococcus faecalis</i>), 0.06 μ g/mL (<i>Staphylococcus aureus</i>), 0.06 μ g/mL (<i>Staphylococcus epidermidis</i>), respectively.
In Vivo	A40926 (10 mg/kg; 皮下注射; 单剂量) 改善 CD-1 小鼠的败血症模型, 减轻小鼠受到的金黄色葡萄球菌、化脓性链球菌和肺炎链球菌感染, 效果略低于 Teicoplanin (ED50 分别为 1.9、0.33、0.38 mg/kg), 但血清中的浓度比 Teicoplanin 显著更高且持续时间更长[1]。 A40926 (10 mg/kg; 静脉注射/皮下注射; 单剂量) 在雄性 CD 大鼠的药代动力学模型中, 静脉注射后血浆浓度呈幂函数衰减, 终端半衰期=61.22 h, 皮下注射生物利用度近 90%, 120 h 时的尿排泄率 35.9%[2]。	
	Animal Model:	CD-1 mice (male and female, 18-22 g) infected with <i>Staphylococcus aureus</i> , <i>Streptococcus pyogenes</i> , or <i>Streptococcus pneumoniae</i> [1]
	Dosage:	10 mg/kg (dissolved in 10% DMSO, 40% PEG 300, 5% Tween-80, and 45% saline)
	Administration:	Subcutaneous injection, single dose
	Result:	Demonstrated protective efficacy against systemic infections caused by gram-positive pathogens, with ED ₅₀ values of 1.9 mg/kg for <i>S. aureus</i> , 0.33 mg/kg for <i>S. pyogenes</i> , and 0.38 mg/kg for <i>S. pneumoniae</i> . Although slightly less effective than Teicoplanin in survival rates, achieved peak serum concentrations of 128 μ g/mL and maintained effective levels (>1 μ g/mL) for over 72 h, indicating prolonged exposure compared to Teicoplanin.



	Animal Model:	Male CD rats (161-185 g) for pharmacokinetic analysis[2]			
	Dosage:	10 mg/kg (formulated in 10% DMSO and 90% corn oil for s.c.)			
	Administration:	Intravenous or subcutaneous injection, single dose, 1 cycle.			
	Result:	Displayed a tri-exponential plasma concentration profile with a terminal half-life of 61.22 h, mean residence time of 84.5 h, and total clearance of 0.11 L/h/kg. Subcutaneous injection resulted in rapid absorption (T _{max} =2 h) and high bioavailability (~90%). Urinary excretion accounted for 35.9% of the administered dose within 120 h, primarily as unchanged drug, while fecal excretion was minimal (<5%).			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 5.88 mg/mL (3.39 mM; ultrasonic and warming and heat to 20°C; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	0.5772 mL	2.8860 mL	5.7719 mL
		5 mM	---	---	---
		10 mM	---	---	---
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 0.59 mg/mL (0.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.59 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 5.9 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 0.59 mg/mL (0.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.59 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。					



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 5.9 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 0.59 mg/mL (0.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.59 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 5.9 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Goldstein BP, et al. A40926, a new glycopeptide antibiotic with anti-Neisseria activity. Antimicrob Agents Chemother. 1987 Dec;31(12):1961-6. [2]. Bernareggi A, et al. Pharmacokinetics of A40926 in rats after single intravenous and subcutaneous doses. Antimicrob Agents Chemother. 1988 Feb;32(2):246-9.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month。 -80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	0.5772 mL	2.8860 mL	5.7719 mL	14.4298 mL

源叶