

Teikoplanin

DEKLARATION

Teikoplanin (J01XA02) är ett tricykliskt glykopeptidantibiotikum som hämmar grampositiva bakteriers cellväggssyntes på ett tidigare stadium än betalaktamantibiotika. Medlet är avsett för parenteralt bruk.

RAFS BEDÖMNING

Teikoplanin har aktivitet mot *Staphylococcus aureus* och i något mindre grad mot koagulasnegativa stafylokocker, inklusive de meticillinresistenta. Preparatet har även aktivitet mot enterokocker. Det är ett alternativ till vancomycin vid infektioner orsakade av MRSA där parenteral behandling krävs. En fördel är att det kan ges en gång per dag, men en nackdel är att många koagulasnegativa stafylokocker kan ha låggradig, och i vissa fall höggradig resistens. Teikoplanin liksom vankomycin är ett sämre alternativ jämfört med isoxazolylpenicillin vid infektioner orsakade av meticillinkänsliga stafylokocker.

RAF uppmanar till restriktiv användning av glykopeptidantibiotika (vankomycin och teikoplanin) pga risken för resistensutveckling.

FARMAKODYNAMIK

Glykopeptider har i huvudsak bakteriostatisk effekt. De interfererar i cellväggssyntesen på ett tidigare stadium än betalaktamantibiotika. Teikoplanin förhindrar tvärbindingen av peptidoglykan i cellväggssyntesen.

Aktivitet teikoplanin

- **God aktivitet:** Stafylokocker, streptokocker (inklusive pneumokocker), enterokocker.
 - **Lägre aktivitet (nativ population i I-grupp):** vissa koagulasnegativa stafylokocker
 - **Otillräcklig aktivitet:** Gramnegativa bakterier, aeroba grampositiva stavbakterier, anaeroba bakterier.
-

BRYTPUNKTER

- **Icke-artrelaterade brytpunkter:** Data saknas.
- **Kliniska brytpunkter (Artrelaterade brytpunkter som korrelerar till klinisk behandlingseffekt):** Stafylokocker, streptokocker (inklusive pneumokocker), enterokocker.

MIC- och zonbrytpunkter redovisas i separat tabell (<http://www.srga.org/MICTAB/Brytpunktstabeller%20RAF-M%20v1.1.xls>).

RESISTENSUTVECKLING

- **Resistensmekanismer:** ett flertal gener som kodar för glykopeptidresistens (*vanA*, *vanB*, *vanC*, *vanD*, *vanE*, *vanG*) har beskrivits. De flesta av dessa har beskrivits hos enterokocker, främst *E.faecalis* och *E.faecium*. Naturligt förekommer glykopeptidresistens hos vissa enterokocker (*E.gallinarum* och *E.casseliflavus*) och hos lactobaciller. *vanC* kodar för naturlig glykopeptidresistens. Hos *Staphylococcus aureus* har c:a 10 stammar med höggradig resistens på basen av *vanA*-genen beskrivits. Mer vanligt förekommande är stafylokocker med låggradig resistens mot glykopeptider (GISA och GISE). De har rapporterats både utomlands och i Sverige. Mekanismen är ofullständigt kartlagd, men fenomenet tros bero på en förtjockning av cellväggen. Ytterligare en typ av glykopeptidresistens hos stafylokocker är den sk "heteroresistensen" (hGISA och hGISE), dvs förekomst av resistenta subpopulationer som kan växa under antibiotiketryck. Denna resistens kan endast detekteras med specialmetoder och förekomsten är sannolikt underskattad. Glykopeptidresistens hos stafylokocker förekommer oftast hos meticillinresistenta stafylokocker.
 - **Korsresistens:** korsresistens med vancomycin för alla enterokocker med *vanA* och hos vissa stammar med *vanD*. Teicoplanin kan inducera vankomycinresistens hos enterokocker med *vanB*.
 - **Resistens sällsynt (<1%):** *Enterococcus faecalis*, *Enterococcus faecium*, *S. aureus*
 - **Resistens förekommer (1 - 10 %):** Koagulasnegativa stafylokocker
 - **Resistens är vanlig (>10 %):** -
 - **Internationella trender:** Ökande förekomst av glykopeptidresistenta enterokocker i Europa, både på sjukhus och i samhället.
-

FARMAKOKINETIK

- **Serumkoncentration:** 25 - 40 mg/L 1 timme efter 400 mg intravenöst.
- **Skenbar distributionsvolym:** 1 - 4 L/kg.
- **Serumproteinbindning:** 90%
- **Halveringstid:** Flerexponentiell utsöndringsprofil. Terminal halveringstid 150 ± 57 timmar. Halveringstiden förlängs med sviktande njurfunktion.

- **Metabolism och elimination:** Teikoplanin utsöndras huvudsakligen renalt genom glomerulär filtration. Vid normal njurfunktion utsöndras ca 80 % av given dos oförändrad i urinen inom 24 timmar.
 - **Aktiva metaboliter:** Nej
 - **Viktig interaktion:** -
-

Referensgruppen för antibiotikafrågor (RAF)

Uppdaterat 2010-12-16