·综 述·

抗感染药物奥利万星的临床研究进展

卢 强，汤 文，李 会，奕 栋，谭 俊*
（中国医药工业研究总院，上海 201203）

摘要：奥利万星是一种新型糖肽类抗菌药物，对多重耐药菌具有广谱抗菌活性，特别对耐甲氧西林金黄色葡萄球菌和万古霉素耐药菌株具有极佳的抗菌活性。奥利万星主要用于治疗革兰氏阳性菌引起的急性细菌性皮肤及皮肤结构感染，具有给药便携性优势。该文主要对奥利万星的临床研究作综述，以期为其临床应用提供参考。

关键词：奥利万星；耐甲氧西林金黄色葡萄球菌；急性细菌性皮肤及皮肤结构感染
中图分类号：R978.1 **文献标志码：**A **文章编号：**1672-9188（2026）08-0946-005
引用：卢强, 汤文, 李会, 等. 抗感染药物奥利万星的临床研究进展[J]. 世界临床药物, 2026, 47(8): 946-950. DOI：10.13683/j.wph.2026.08.017

Clinical research progress of the anti-infective drug oritavancin

LU Qiang, TANG Wen, LI Hui, YI Dong, TAN Jun*
(*China State Institute of Pharmaceutical Industry, Shanghai 201203, China*)

Abstract: Oritavancin is a novel antimicrobial agents with broad-spectrum antibacterial activity against multi-drug resistant bacteria, particularly showing excellent activity against methicillin-resistant *Staphylococcus aureus* and vancomycin-resistant strains. Oritavancin is mainly used to treat acute bacterial skin and skin structure infections caused by Gram-positive bacteria and offers the advantage of convenient administration. This article mainly reviewed the clinical studies and related aspects of oritavancin, in order to provide reference for its clinical application.

Key words: oritavancin; methicillin-resistant *Staphylococcus aureus*; acute bacterial skin and skin structure infections

耐甲氧西林金黄色葡萄球菌（methicillin-resistant *Staphylococcus aureus*，MRSA）于20世纪60年代首次被报道，其多重耐药特性导致临床治疗非常困难，是医院感染和社区感染的重要病原体之一[1]，美国疾病控制与预防中心将其列为严重威胁，世界卫生组织在2024年将其列入《细菌优先病原体清单》的“高危组”[2]。由于细菌耐药性的日益严重，抗菌药物的研发迫在眉睫[3]，万古霉素（vancomycin）等糖肽类抗菌药物因良好的杀菌效果及极低的耐药突变频率，一度被认为是治疗革兰氏阳性病原菌感染的“最后一道防线”。但随着超级细菌的出现，糖肽类抗菌药物也面临严峻的耐药问题，因此研究人员开发了新型脂糖肽类抗菌药物。

奥利万星（oritavancin）是一种新型糖肽类抗菌药物，于2014年获得美国食品药品监督管理局（Food and Drug Administration，FDA）批准用于临床，治疗革兰氏阳性菌引起的急性细菌性皮肤及皮肤结构感染（acute bacterial skin and skin structure infection，

收稿日期：2026-03-11
作者简介：卢强，硕士研究生，研究方向：微生物药物。
通信作者：谭俊，副研究员，研究方向：微生物药物。
基金项目：上海市2023年度“科技创新行动计划”启明星项目（扬帆专项）（23YF1445700）

ABSSSI)[4]。该药具有超长半衰期，对金黄色葡萄球菌、肠球菌属及链球菌属均表现出强效抗菌活性[5]。本文主要围绕奥利万星临床研究进行综述，以期为其临床应用提供参考。

1 奥利万星的药理学特性

奥利万星是天然产物 chloroeremomycin 的半合成衍生物，与第一代脂糖肽类抗菌药物万古霉素不同的是，其在体内更易发生二聚化，使结构更加稳定，有利于与靶点结合，锚定在细菌细胞膜中，破坏细胞膜超微结构，促进细菌杀灭[6-7]，进一步增加药物活性。

1.1 药效学

奥利万星的抗菌活性达 99.7% 以上，且最低抑菌浓度（minimum inhibitory concentration，MIC）低于 FDA 规定的 0.12 μg/mL 这一敏感性临界值[8]。奥利万星对葡萄球菌的 90%MIC 为 0.06 μg/mL，分别为达托霉素（daptomycin）、万古霉素及利奈唑胺（linezolid）的 1/8、1/16 及 1/32，其抗菌活性显著优于上述药物[9]。凝固酶阴性葡萄球菌是新生儿院内感染的常见病原体之一，可诱发危及生命的迟发性败血症（septicemia）[10]，该菌株对奥利万星敏感。奥利万星对主要革兰氏阳性致病菌的体外 MIC 范围参见表 1[11-14]。

表 1 奥利万星对主要革兰氏阳性致病菌的体外 MIC 范围

Table 1 *In vitro* MIC range of orivanxin against major Gram-positive pathogenic bacteria

菌株	MIC范围/μg·mL^{-1}
甲氧西林敏感金黄色葡萄球菌	0.13～1
耐甲氧西林金黄色葡萄球菌	0.13～4
万古霉素中度耐药金黄色葡萄球菌	1～8
甲氧西林敏感表皮葡萄球菌	0.25～1
耐甲氧西林表皮葡萄球菌	0.25～4
甲氧西林敏感溶血性链球菌	0.06～1
耐甲氧西林溶血性链球菌	0.13～1
甲氧西林敏感凝固酶阴性葡萄球菌	0.06～0.5
耐甲氧西林凝固酶阴性葡萄球菌	≤0.03～0.5
化脓性链球菌	0.016～0.13
青霉素敏感肺炎链球菌	≤0.002～0.06
青霉素耐药肺炎链球菌	≤0.002～0.06
青霉素敏感链球菌	≤0.01
青霉素耐药链球菌	0.01～0.06
万古霉素敏感肠球菌属	0.06～0.25
肠球菌属VanA型	0.06～1
肠球菌属VanB型	≤0.03～0.13
肠球菌属VanC型	≤0.03～1
芽孢杆菌属	≤0.015～0.5
李斯特菌属	≤0.03～0.125
艰难梭菌	0.016～2
产气荚膜梭菌	0.016～2
流感嗜血杆菌	16～32

1.2 药代动力学

奥利万星单次给药剂量为 1 200 mg，静脉输注，其 0 ～ 24 h 及总药 - 时曲线下面积分别为 1 110 和 2 800 μg·h·mL^{-1}，药峰浓度为 138 μg/mL[15]。奥利万星结构中的脂质部分可增强血浆蛋白结合率，其血浆蛋白结合率达 85%[16-17]，其最大血浆浓度约为炎症组织液浓度的 11 倍[18]，表明药物作用时间持久。奥利万星主要以原形经尿液和粪便排出体外，未检测到其他代谢产物[19]；群体药代动力学分析表明，其消除过程缓慢，终末半衰期约 245 h，清除率为 0.445 L/h[20]。单次静脉给药后约 6% 的药物在 1 周内被清除[21]。

1.3 药物相互作用

单次输注 1 200 mg 奥利万星可诱导细胞色素 P450 酶（CYP3A4 和 CYP2D6）活性，导致咪达唑仑（midazolam）和右美沙芬（dextromethorphan）血药浓度降低[22]；同时，奥利万星也是 CYP2C19 和 CYP2C9 的弱抑制剂，与奥美拉唑（omeprazole）和华法林（warfarin）联用时，会导致后者血药浓度升高。尽管存在上述药物相互作用，奥利万星在肾功能或肝功能受损患者中无需调整剂量。

2 奥利万星临床研究

2.1 ABSSSI

单次注射奥利万星治疗 ABSSSI 的效果与万古

霉素（一日 2 次，持续 7 ～ 10 d）相当[15]，这可能与其具有较长半衰期有关[23]。一项纳入 5 项临床研究、共 9 213 例患者的 meta 分析[24]显示，奥利万星治疗 ABSSSI 的效果与万古霉素相当，主要治疗终点风险比（risk ratio，RR）为 1.00［95% 置信区间（confidence interval，CI）：0.93 ～ 1.08］，临床治愈率 RR 为 1.03（95%CI：0.95 ～ 1.11），且对 MRSA 感染同样有效（RR ＝ 1.01，95% CI：0.92 ～ 1.11）。同时，奥利万星在临床真实表现更为优秀，其能使 30 d 再入院率将至 58%（RR ＝ 0.42，P ＝ 0.000 4），并在门诊环境中将 30 d 急诊就诊率降低 66%（RR ＝ 0.34，P ＜ 0.000 01）。安全性方面，奥利万星不良反应发生率显著低于万古霉素（RR ＝ 0.78，P ＝ 0.002），而总体不良事件、严重不良事件和死亡率均无显著差异。上述数据支持奥利万星作为一种疗效确切、安全性良好的治疗方案用于 ABSSSI 的治疗。

Whittaker 等[25]发现，与对照药物相比，奥利万星可显著缩短 ABSSSI 患者住院时间。Helton[26]等的临床研究证实了这一结果，且在急诊科中观察到类似疗效。此外，研究[27]表明，与单次治疗（1 200 mg）相比，奥利万星双剂量治疗（1 200 与 800 mg 间隔 1 周）的窗口期可延长 11 d。但有病例分析显示，多剂量与单剂量奥利万星治疗 ABSSSI 的疗效相当[15]。

2.2 骨关节感染

研究[28]显示，在骨关节感染患者中，奥利万星首次 1 200 mg 随后追加 3 ～ 4 次 800 mg 的给药方案治疗成功率在 70% ～ 90%。奥利万星也被用于治疗万古霉素耐药肠球菌（Vancomycin-Resistant *Enterococcus*，VRE）引起的骨关节感染。虽然患者对奥利万星总体耐受良好，但现有研究样本量有限，仍需更大规模的研究来评估其疗效及安全性。此外，还需开展 VRE 抗菌药物敏感性试验及治疗药物监测研究，以进一步明确奥利万星在 VRE 所致骨关节感染中的作用，并确定其在这些场景中最有效且最安全的给药方案。Krsak 等[29]报告一组 VRE 骨关节感染患者的小型异质性病例，这些患者接受奥利万星治疗后取得一定疗效，且不良反应较少。基于这些发现，在 VRE 所致骨髓炎手术治疗后，外科医生可采用奥利万星进行抗感染治疗，为其他复杂情况下的棘手感染提供新的用药思路。

2.3 心血管感染

一项回顾性观察研究[30]显示，奥利万星可用于治疗革兰氏阳性菌所致的左心室辅助装置相关心血管感染，其治疗有效率约 66.7%，但该研究纳入病例数较少，且为回顾性研究，其结果仅能在临床决策时提供参考，无法作为决策制定依据。虽然现有研究大多表明奥利万星在心血管移植物相关感染中具有疗效[31]，但大部分研究针对的致病菌为金黄色葡萄球菌[32]，对于奥利万星在耐药革兰氏阳性菌及肠球菌感染中的有效性及安全性还需开展更多研究明确。

2.4 其他

Brownell 等[33]发现，奥利万星可有效治疗革兰氏阳性菌引起的手术伤口感染，安全性良好，并可缩短患者住院时间[34]。此外，ORKIDS 研究[35]提出了奥利万星的儿科给药方案，为未来革兰氏阳性菌感染患儿的治疗提供新方案。

2.5 不良反应

奥利万星耐受性良好，其不良反应发生率与万古霉素相当，大多轻微且停药后短期内即可恢复正常[36]。Ⅲ期临床试验[37]显示，奥利万星常见不良反应包括头痛、恶心、呕吐、肢体 / 皮下脓肿、腹泻以及谷丙转氨酶可逆性升高。需要注意的是，奥利万星可能增加华法林血浆浓度及出血风险，因此不能与华法林联用[26]。此外，奥利万星还可能引发红人综合征[38]。

3 结语

目前，奥利万星已被证实具有抗菌谱广、安

全性高以及与其他药物之间的相互作用风险低等优势，尤其对革兰氏阳性菌引起的感染具有良好应用前景，但仍需开展更多研究探索疗效及安全性，奥利万星的临床应用仍有限，其在治疗生物膜相关感染及 VRE 中的作用尚未充分探索。

药物成本也是后续研究人员需关注的问题之一。目前，奥利万星的关键前体 A82846B 合成仍然存在一些亟待解决的问题，主要包括生产过程中出现单卤化杂质 A82846A 和未卤化杂质 A82846C，导致双卤化的奥利万星 A82846B 分离纯化过程复杂、成本高。希望能从酶学角度降低杂质，提高产量，从根本上解决奥利万星的经济性及可及性问题，使其成为临床治疗细菌感染的一线药物。

参考文献：

[1] Turner N A, Sharma-Kuinkel B K, Maskarinec S A, *et al*. Methicillin-resistant *Staphylococcus aureus*: an overview of basic and clinical research[J]. Nat Rev Microbiol, 2019, 17(4): 203-218.

[2] Galfo V, Tiseo G, Riccardi N, *et al*. Therapeutic drug monitoring of antibiotics for methicillin-resistant *Staphylococcus aureus* infections: an updated narrative review for clinicians[J]. Clin Microbiol Infect, 2025, 31(2): 194-200.

[3] 刘珊, 樊钱永. 沈舜义. 抗生素临床研究新进展[J]. 世界临床药物, 2017, 38(3): 200-203.

[4] Jean S S, Liu I M, Hsieh P C, *et al*. Off-label use versus formal recommendations of conventional and novel antibiotics for the treatment of infections caused by multidrug-resistant bacteria[J]. Int J Antimicrob Agents, 2023, 61(5): 106763.

[5] Pfaller M A, Sader H S, Flamm R K, *et al*. Oritavancin *in vitro* activity against Gram-positive organisms from European and United States medical centers: results from the SENTRY antimicrobial surveillance program for 2010—2014[J]. Diagn Microbiol Infect Dis, 2018, 91(2): 199-204.

[6] Hussein M, Barclay J, Baker M, *et al*. A comparative review of the pharmacology of dalbavancin and oritavancin for Gram-positive infections: birds of a feather or apples and oranges[J]. Infect Dis Ther, 2025, 14(10): 2221-2246.

[7] Gavaruzzi F, Granata G, Capone A, *et al*. Long-term therapy with long-acting lipoglycopeptide antibiotics in the treatment of cardiovascular prosthetic infections: a systematic review[J]. Antibiotics(Basel), 2025, 14(11): 1130.

[8] Mendes R E, Sader H S, Castanheira M, *et al*. Distribution of main Gram-positive pathogens causing bloodstream infections in United States and European hospitals during the SENTRY antimicrobial surveillance program(2010—2016): concomitant analysis of oritavancin *in vitro* activity[J]. J Chemother, 2018, 30(5): 280-289.

[9] van Groesen E, Innocenti P, Martin N I. Recent advances in the development of semisynthetic glycopeptide antibiotics: 2014—2022[J]. ACS Infect Dis, 2022, 8(8): 1381-1407.

[10] 张献, 冯欣. 万古霉素在早产儿抗感染中的应用进展[J]. 世界临床药物, 2022, 43(12): 1534-1540.

[11] Werth B J, Zhang R T, Barreras Beltran I A, *et al*. Simulated exposures of oritavancin in in vitro pharmacodynamic models select for methicillin-resistant *Staphylococcus aureus* with reduced susceptibility to oritavancin but minimal cross-resistance or seesaw effect with other antimicrobials[J]. J Antimicrob Chemother, 2025, 80(4): 1108-1115.

[12] Belley A, Lalonde seguin D, Arhin F, *et al*. Comparative *in vitro* activities of oritavancin, dalbavancin, and vancomycin against methicillin-resistant *Staphylococcus aureus* isolates in a nondividing state[J]. Antimicrob Agents Chemother, 2016, 60(7): 4342-4345.

[13] Turicchi G, Bongiovanni M. Oritavancin in a patient with recurrent endocarditis by *Enterococcus faecalis*: a new therapeutic option[J]. J Antimicrob Chemother, 2025, 80(10): 2873-2874.

[14] Yan Q, Karau M J, Patel R. *In vitro* activity of oritavancin against biofilms of staphylococci isolated from prosthetic joint infection[J]. Diagn Microbiol Infect Dis, 2018, 92(2): 155-157.

[15] Lodise T P, Redell M, Armstrong S O, *et al*. Efficacy and safety of oritavancin relative to vancomycin for patients with acute bacterial skin and skin structure infections(ABSSSI) in the outpatient setting: results from the SOLO clinical trials[J]. Open Forum Infect Dis, 2017, 4(1): ofw274.

[16] Frondizi F, Leanza G M, Chiuchiarelli M, *et al*. The use of oritavancin as consolidation therapy for infective endocarditis caused by *Enterococcus* spp[J]. Open Forum Infect Dis, 2025, 12(8): ofaf416.

[17] Ciusa G, Pipitone G, Mancuso A, *et al*. One-shot, one opportunity: retrospective observational study on long-acting antibiotics for SSTIs in the emergency room - a real-life

experience[J]. Pathogens, 2025, 14(8): 781.

[18] Rubino C M, Bhavnani S M, Moeck G, *et al*. Population pharmacokinetic analysis for a single 1 200-milligram dose of oritavancin using data from two pivotal phase 3 clinical trials[J]. Antimicrob Agents Chemother, 2015, 59(6): 3365-3372.

[19] Syed Y Y, Scott L J. Oritavancin: a review in acute bacterial skin and skin structure infections[J]. Drugs, 2015, 75(16): 1891-1902.

[20] Birlutiu R M, Birlutiu V. Oritavancin a therapeutic option for periprosthetic joint infections in selected cases: a comprehensive review[J]. Pharmaceuticals(Basel), 2025, 18(8): 1217.

[21] Krsak M, Klimpl D, Mueller S W, *et al*. Oritavancin for treatment of osteomyelitis: a systematic review and meta-analysis of observational studies[J]. Pharmacotherapy, 2025, 45(11): 754-763.

[22] Brade K D, Rybak J M, Rybak M J. Oritavancin: a new lipoglycopeptide antibiotic in the treatment of Gram-positive infections[J]. Infect Dis Ther, 2016, 5(1): 1-15.

[23] Domenech O, Dufrene Y F, van Bambeke F, *et al*. Interactions of oritavancin, a new semi-synthetic lipoglycopeptide, with lipids extracted from *Staphylococcus aureus*[J]. Biochim Biophys Acta, 2010, 1798(10): 1876-1885.

[24] Zhang H, Zhou W Y, Wang J, *et al*. Efficacy and safety of oritavancin for the treatment of acute bacterial skin and skin-structure infections: a systematic review and meta-analysis[J]. J Glob Antimicrob Resist, 2021, 25: 380-389.

[25] Whittaker C, Lodise T P, Nhan E, *et al*. Expediting discharge in hospitalized, adult patients with skin and soft tissue infections who received empiric vancomycin therapy with oritavancin: description of findings from an institutional pathway[J]. Drugs Real World Outcomes, 2020, 7(Suppl 1): 30-35.

[26] Helton B, MacWhinnie A, Minor S B, *et al*. Early directed oritavancin therapy in the emergency department may lead to hospital avoidance compared to standard treatment for acute bacterial skin and skin structure infections: a real-world retrospective analysis[J]. Drugs Real World Outcomes, 2020, 7(Suppl 1): 20-29.

[27] Rose W E, Hutson P R. A two-dose oritavancin regimen using pharmacokinetic estimation analysis[J]. Drugs Real World Outcomes, 2020, 7(Suppl 1): 36-40.

[28] Raza Z A, Giannini A, Bongiovanni M, *et al*. Oritavancin for Gram-positive bone and joint infections: a comprehensive review of the literature[J]. Antibiotics(Basel), 2026, 15(2): 226.

[29] Krsak M, Morrisette T, Damioli L, *et al*. Can oritavancin be used for treatment and/or suppressive antimicrobial therapy of bone and joint infections caused by vancomycin-resistant *Enterococcus faecium*[J]. Clin Orthop Relat Res, 2025, 483(7): 1225-1233.

[30] Giuliano S, Martini L, Merelli M, *et al*. Oritavancin as consolidation or suppressive therapy in infective endocarditis and device-related infections: real-world experience with therapeutic drug monitoring[J]. JAC Antimicrob Resist, 2026, 8(4): dlag150.

[31] Miller W R, Murray B E, Rice L B, *et al*. Resistance in vancomycin-resistant enterococci[J]. Infect Dis Clin North Am, 2020, 34(4): 751-771.

[32] Lupia T, de Benedetto I, Bosio R, *et al*. Role of oritavancin in the treatment of infective endocarditis, catheter- or device-related infections, bloodstream infections, and bone and prosthetic joint infections in humans: narrative review and possible developments[J]. Life(Basel), 2023, 13(4): 959.

[33] Brownell L E, Adamsick M L, McCreary E K, *et al*. Clinical outcomes and economic impact of oritavancin for Gram-positive infections: a single academic medical center health system experience[J]. Drugs Real World Outcomes, 2020, 7(Suppl 1): 13-19.

[34] Scoble P J, Reilly J, Tillotson G S. Real-world use of oritavancin for the treatment of osteomyelitis[J]. Drugs Real World Outcomes, 2020, 7(Suppl 1): 46-54.

[35] Bradley J, Arrieta A, Bokesch P, *et al*. 1719. Pharmacokinetics(PK) of oritavancin in children: the ORKIDS trial[J]. Open Forum Infect Dis, 2018, 5(Suppl 1): S52.

[36] 叶静, 肖婷婷, 王雪婷, 等. 新型抗菌药物研究进展与临床应用[J]. 药学进展, 2021, 45(6): 403-412.

[37] Mitra S, Saeed U, Havlichek D H, *et al*. Profile of oritavancin and its potential in the treatment of acute bacterial skin structure infections[J]. Infect Drug Resist, 2015, 8: 189-197.

[38] Shaju A M, Panicker N, Chandni V, *et al*. Drugs-associated with red man syndrome: an integrative approach using disproportionality analysis and Pharmip[J]. J Clin Pharm Ther, 2022, 47(10): 1650-1658.

（编辑：王 佳）