

Catalog Number: CM11704

产品信息

Catalog Number:
CM11704

CAS号:
1001404-83-6

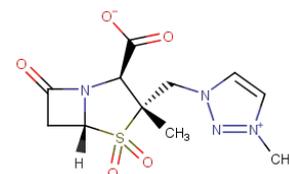
分子式:
C₁₁H₁₄N₄O₅S

主要靶点:
Antibacterial

主要通路:
微生物学

分子量:
314.32

溶解度:
DMSO:113.3 mg/mL (360.46 mM)



体外活性

Enmetazobactam是一种新型的扩展谱β-内酰胺酶抑制剂。在223个对头孢吡肟不敏感的分离株中，95%对头孢他啶不敏感，49%对依他培南不敏感，57%对哌拉西林/他唑巴坦不敏感，90%属于多重耐药（对3类药物耐药），22%产生碳青霉烯酶，67%产生ESBLs。添加Enmetazobactam后，能显著降低头孢吡肟的最小抑菌浓度（MIC₅₀），从>64 mg/L降至头孢吡肟/Enmetazobactam的0.13 mg/L，支持其在治疗这些微生物引起的感染中继续开发使用。Enmetazobactam对特定耐药表型表现出强大的活性，其MIC₅₀和MIC₉₀分别为0.125 mg/L和64 mg/L[1]。对于大多数菌株，随着Enmetazobactam浓度的增加（在1至16 mg/L范围内），头孢吡肟-Enmetazobactam的MICs显示出降低趋势，这表明Enmetazobactam在恢复头孢菌素类抗菌活性方面呈现浓度依赖性[1]。

体内活性

针对一组主要产生碳青霉烯酶、对头孢吡肟不敏感的肠杆菌科菌株（共20株），我们评估了在不同固定Enmetazobactam浓度（1, 2, 4, 8, 和16 mg/liter）下头孢吡肟的最小抑菌浓度（MICs），以及在中性粒细胞减少的小鼠大腿感染模型中模拟人体剂量的头孢吡肟和头孢吡肟-Enmetazobactam的体内功效。在接种后2小时，小鼠分别接受了模拟给予人体每8小时2g头孢吡肟（作为30分钟输注）和每8小时2g/0.5g头孢吡肟-Enmetazobactam（作为30分钟输注）时观察到的自由化合物浓度-时间曲线的方案。有效性通过计算与起始接种量相比24小时后大腿细菌密度（对数10 CFU数）的变化确定。24小时后，对照组动物观察到的细菌生长为2.7±0.1对数10 CFU（平均标准误）。头孢吡肟单一化合物治疗仅对3株菌有效，而其余17株（所有头孢吡肟MICs为64 mg/liter）的细菌密度增加类似于对照组动物。人化的头孢吡肟-Enmetazobactam给药方案对12株中的20株菌株实现了0.5对数10 CFU的细菌减少。

储存

keep away from moisture, store under nitrogen, store at low temperature | Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year | Shipping with blue ice.