

阿维巴坦钠 ; Avibactam Sodium Salt

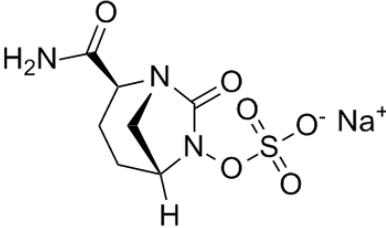
产品编号 : MB2494

质量标准 : ≥99.0%

包装规格 : 50MG ; 200MG ;

产品形式 : 白色至类白色粉末

基本信息

分子式	C7H10N3NaO6S	结 构 式	
分子量	287.23		
CAS No.	1192491-61-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	Water:50mg/mL		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介 : 阿维巴坦钠 Avibactam sodium 是一种共价, 可逆的 β-内酰胺酶 (β-lactamase) 抑制剂, 抑制 β-lactamase TEM-1 和 CTX-M-15, IC₅₀ 分别为 8 nM 和 5 nM。

别名 : NXL-104 ; Avibactam Sodium Salt ; 阿维巴坦钠

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色粉末

溶解性 :Water:50mg/mL

含量 :≥99.0%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Avibactam sodium is a covalent, reversible β-lactamase inhibitor, inhibits β-lactamase TEM-1 and CTX-M-15 with IC ₅₀ of 8 nM and 5 nM, respectively.
靶点	IC50: 8 nM (TEM-1), 5 nM (CTX-M-15)
体外研究	Avibactam (NXL104) 钠是一种抗菌活性很小的分子, 可抑制 A 类和 C 类β-内酰胺酶。除了金属类型和不动杆菌 OXA 碳青霉烯酶外, Avibactam 还能灭活最重要的β-内酰胺酶。
体内研究	Avibactam 钠显示出缓慢的活性恢复, 解离率为 0.045±0.022min ⁻¹ , 转化为停留时间半衰期 (tt1 / 2) 为 16±8min。 Avibactam 的测量解离速率表明通过水解或可逆性发生缓慢的脱酰作用, 并且与先前报道的对于 Avibactam 抑制 TEM-1 的≥1 或 > 7d 的极长 t1 / 2 值形成对比。 Avibactam 是一种新型有希望的β-内酰胺酶抑制剂, 可克服β-内酰胺酶引起的耐药性。小鼠肌肉注射大约 10 ⁶ CFU 的铜绿假单胞菌进入大腿或鼻内引起肺炎, 并给予 8 种不同 (单一) 皮下

	剂量的头孢他啶和阿维巴坦，各种浓度范围为 1 至 128 mg / kg 体重增加了 2 倍。终末期头孢他啶血浆的平均估计半衰期为 0.28 小时 (标准差, 0.02 小时) ，阿维西坦平均估计半衰期为 0.24 小时 (标准差, 0.04 小时) 。分配量分别为 0.80 升/ kg (SD , 0.14 升/ kg) 和 1.18 升/ kg (SD , 0.34 升/ kg) 。
--	---

用途及描述 : 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。阿维巴坦钠 (NXL-104) 是一种新型的非 β -内酰胺类的 β -内酰胺酶抑制抗生素。阿维巴坦作为一种新型的非 β -内酰胺类的 β -内酰胺酶抑制剂, 可以与头孢洛林联合使用, 具有广谱抗菌活性。虽然阿维巴坦自身并没有明显的抗菌活性, 但是能抑制 A 型和 C 型的 β -内酰胺酶。

储液配置 :

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	3.4815 mL	17.4077 mL
5 mM	0.6963 mL	3.4815 mL	6.9631 mL
10 mM	0.3482 mL	1.7408 mL	3.4815 mL
50 mM	0.0696 mL	0.3482 mL	0.6963 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	在 200 μ L 的反应体积中, 将 1 μ M TEM-1 与 5 μ M Avibactam 和不用 Avibactam 一起在 37 $^{\circ}$ C 下孵育 5 分钟, 并经两个超滤筒(UFC)步骤去除过量抑制剂(具有 Biomax 膜的 Ultrafree-0.5 , 5-kDa 截止)。在 10600 \times g 下离心 8min , 每次超滤后, 用 180 μ L 测定缓冲液稀释 20 μ L 残留物, 恢复酶原浓度。经过两次 UFC 处理后, 用液相色谱/质谱/质谱联用技术测定了游离阿维巴坦的含量, 发现其含量小于原浓度的 5%。通过测定酰基酶样品中 TEM-1 活性(稀释 4000 倍)来评估 UFC 过程中蛋白质的损失, 发现损失小于 5%。
细胞实验	将过夜培养液中的细胞(~10 ⁹ cfu)涂布在米勒-辛顿琼脂上, 琼脂中添加(i)头孢他林加 Avibactam(1 或 4mg/L)1-16 \times MICs, 或(ii)头孢他林加 Avibactam 1-8 \times 将头孢他林 MIC 降至 1 或 4mg/L。在过夜孵育后计数菌落。
动物实验	小鼠 将阿维菌素在无菌水中重组为 5120 mg/L 的原液, 在 Mueller Hinton 肉汤中制备进一步的溶液。在实验中使用近交雌性 CD-1 小鼠, 7 至 8 周龄, 体重 20 至 25 克。使用八个剂量组合。对于大腿感染动物, 头孢他啶和阿维巴坦的组合分别为 16/4、8/1、64/32 和 2/128 mg/kg。对于肺部感染的小鼠, 使用 32/16、4/2、128/8 和 1/64 mg/kg 的各组合的组合。选择这些组合以检测两种化合物 (头孢他啶和阿维巴坦) 之间可能的药代动力学相互作用, 并覆盖每种化合物的宽剂量范围。

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

参考文献

- [1] Zhanel GG, et al. *Drugs*. 2013, 73(2):159-77.
- [2] Lahiri SD, et al. *Antimicrob Agents Chemother*. 2014, 58(10):5704-13.
- [3]. Livermore DM, et al. Characterization of β -lactamase and porin mutants of Enterobacteriaceae selected with ceftaroline + avibactam (NXL104). *J Antimicrob Chemother*. 2012 Jun;67(6):1354-8.

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。