

## 论文

### 含4-噻唑啉酮环的新烟碱类化合物的合成及生物活性

孙小军\*, 苏娜, 刘幸海, 董卫莉, 李正名, 赵卫光

南开大学元素有机化学国家重点实验室, 农药国家工程研究中心, 天津 300071

#### 摘要:

根据生物等排原理和新烟碱类化合物与乙酰胆碱酯酶的作用机理, 以4-噻唑啉酮(4)为中间体设计合成了2-取代-3-(2-氯-5-吡啶亚甲基)-4-氰基亚胺基-1,3-噻唑啉烷(8a~8c)和5-芳基次甲基-2-芳基-3-(2-氯-5-吡啶亚甲基)-4-噻唑啉酮(5a~5e)两类化合物. 中间体(4)由醛、胺和巯基乙酸缩合得到. 所有化合物的结构均经元素分析和<sup>1</sup>H NMR确证. 初步生物活性试验结果表明, 部分化合物具有一定的杀菌活性和促进黄瓜子叶生根活性, 化合物8b显示出很好的抗HIV-1蛋白酶活性.

关键词: 新烟碱 4-噻唑啉酮 生物活性

### Synthesis and Biological Activities of New Neonicotinoids Containing 4-Thiazolidinone

SUN Xiao-Jun, SU Na, LIU Xing-Hai, DONG Wei-Li, LI Zheng-Ming, ZHAO Wei-Guang\*

State Key Laboratory of Elemento-organic Chemistry, Pesticide National Engineering Research Center, Nankai University, Tianjin 300071, China

#### Abstract:

According to bioisosteric relationship and the mode of action between Neonicotinoid compounds and acetylcholin esterase, two series of Neonicotinoid compounds 2-substituted-3-(2-chloro-5-pyridinemethylene)-4-cyanoimino-1,3-thiazolidine(8a—8c) and 5-arylidene-2-aryl-3-(2-chloro-5-pyridinemethylene)-4-thiazolidinones(5a—5e) were designed and synthesized from 4-thiazolidinones(4). Intermediates 4 were synthesized by the condensation of amine, aldehyde and mercapto acetic acid. Their structures were characterized *via* elemental analysis, <sup>1</sup>H NMR spectra. The preliminary bioassay results show that some title compounds exhibited certain fungicidal activities, promoting cucumber cotyledon root-formation activities and compound 8b showed favourable anti-HIV PR.

Keywords: Neonicotinoid 4-Thiazolidinone Biological activity

收稿日期 2007-12-30 修回日期 1900-01-01 网络版发布日期

## 扩展功能

### 本文信息

Supporting info

PDF(368KB)

[HTML全文](OKB)

参考文献[PDF]

参考文献

### 服务与反馈

把本文推荐给朋友

加入我的书架

加入引用管理器

引用本文

Email Alert

文章反馈

浏览反馈信息

### 本文关键词相关文章

▶ 新烟碱

▶ 4-噻唑啉酮

▶ 生物活性

### 本文作者相关文章

▶ 孙小军

▶ 苏娜

▶ 刘幸海

▶ 董卫莉

▶ 李正名

▶ 赵卫光

▶ 孙小军

▶ 苏娜

▶ 刘幸海

▶ 董卫莉

▶ 李正名

▶ 赵卫光

### PubMed

Article by

Article by

Article by

Article by

Article by

Article by

Article by

Article by

Article by

Article by

Article by

Article by

## 参考文献:

1. Samaritoni J. G., Demeter D. A., Gifford J. M., *et al.*. Journal of Agricultural and Food Chemistry [J], 2003, 51(10): 3035—3042
2. WANG Zhong-Yi(王忠义), SHI Hai-Jian(史海键), ZHENG He-Gen(郑和根). Chin. J. Org. Chem.(有机化学)[J], 1994, 14: 190—194
3. Rosaria O., Rosanna M., Maria L. B., *et al.*. Bioorg. Med. Chem.[J], 2005, 13: 4243—4252
4. Jay W., Joseph M. K.. J. Med. Chem.[J], 1989, 32: 2493—2500
5. LIU Xin(刘昕), HUANG Run-Qiu(黄润秋), CHENG Mu-Ru(程募如). Chem. J. Chinese Universities(高等学校化学学报)[J], 1999, 20(9): 1404—1408
6. LI Zhong(李忠), QIAN Xu-Hong(钱旭红), SHAO Xu-Sheng(邵旭升), *et al.*. Compound with High Insecticidal Activity, Its Preparation and Application(一类具有高杀虫活性化合物的制备方法及应用), CN 200610025138.2[P], 2006
7. Glassco W., Nauen R., Beene D. L., *et al.*. J. Med. Chem.[J], 1993, 36: 3381—3385

## 本刊中的类似文章

1. 臧洪俊,李正名,倪长春,沈宙,范志金,刘秀峰.水杨酸类糖酯化合物的合成及其生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2006,27(10): 1877-1880
2. 杨二冰,李永红,刘秀峰,李正名. $\alpha$ -芳氧基乙酸-(2-取代氧基)-苄酯的合成与生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2007,28(6): 1077-1079
3. 屈阳,李振声,杨帮成,张兴栋.成骨肿瘤细胞在纳米氧化钛陶瓷表面的生物活性研究[J]. 高等学校化学学报, 2007,28(7): 1288-
4. 任云峰,刘贵锋,孙艳红,沈玉梅. $\beta$ -榄香烯-TEG-Re(CO)<sub>3</sub>配合物的合成、放射性标记及初步生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2008,29(9): 1765-1768
5. 孙凤梅,石德清,田嫚嫚,谭效松.2-氧代-2-[1-(3-吡啶甲基氨基)-1'-芳基]甲基-4-芳基-5,5-二甲基-1,3,2-二氧磷杂环己烷的合成与生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2006,27(11): 2092-2096
6. 魏太保,唐静,林奇,刘洪,张有明.2-[3-苯氧甲基-4-苯基-[1,2,4]三唑-5-硫基]乙酰胺的合成、晶体结构表征及生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2007,28(6): 1080-1083
7. 连召斌,田晓红,曹玲华.新型胍基葡萄糖苷的合成及生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2007,28(7): 1297-
8. 肖勇军,王建国,刘幸海,李永红,李正名.基于受体结构的AHAS抑制剂的设计、合成及生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2007,28(7): 1280-
9. 臧洪俊,李正名,范志金,刘秀峰,王素华.3-*N*-苄氧羰基- $\beta$ -氨基丁酸糖酯的合成及生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2007,28(8): 1512-1515
10. 董卫莉,姚红伟,王凤龙,李正名,申莉莉,钱玉梅,赵卫光.1,2,3-噻二唑-4-乙酰胺(吗啉)类衍生物的合成与生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2007,28(9): 1671-1676
11. 严铭铭,曲晓波,王旭,刘宁,刘志强,赵大庆,刘淑莹.梅花鹿茸中活性多肽的纯化、测序及功能研究[J]. 高等学校化学学报, 2007,28(10): 1893-1896
12. 胡艾希,贺丽敏,董敏宇,张建宇,欧晓明.2-甲基-1-(4-芳基噻唑-2-基)-苯并咪唑-6-甲酸乙酯的合成、表征及生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2008,29(4): 739-744
13. 王宝雷,李正名,李永红,王素华.酰胺类KARI酶抑制剂的设计、合成和生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2008,29(3): 523-527
14. 宋相伟,王雪丽,熊新辉,牛建丽,王仕擎,王丽萍,李惟.Exendin-4类似物的生物活性及结构[J]. 高等学校化学学报, 2008,29(6): 1163-1165
15. 邢永恒,孙政,葛茂发,白凤英,牛淑云,杨光第,叶玲.蝎型钒氧配合物的合成、结构及量子化学研究[J]. 高等学校化学学报, 2006,27(6): 1096-1100
16. 董卫莉,徐俊英,刘幸海,李正名,李宝聚,石延霞.含1,2,3-噻二唑的邻甲酰胺基苯甲酰胺类化合物的合成、晶体结构与生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2008,29(10): 1990-1994
17. 周宁,付慧君,荣嫡,程卯生,刘克良.含有络合功能基的非天然氨基酸的设计、合成及在生物活性肽中的应用[J]. 高等学校化学学报, 2007,28(4): 668-671
18. 谭海忠,李慧东,王建国,李文明,李永红,李正名.一些吡啶二酮类衍生物的合成及对AHAS的抑制活性[J]. 高等学校化学学报, 2009,30(3): 510-512
19. 李文明,谭海忠,王建国,李永红,李正名.新型芳磺酰基色氨酸酯以及芳磺酰基谷氨酸二酯类化合物的合成与生物活性研究[J]. 高等学校化学学报, 2009,30(4): 728-730

序号	时间	反馈人	邮箱	标题	内容
1	2009-	reviewuins	edfwen@163.com	sdwelle	Buy discount ugg cheap ugg shoes ugg ugg rainier b ugg usa discour boots ugg 582E shoes sale ugg su