

论文

苯甲酰胺类衍生物的合成及扩血管活性

何欣;林紫云;朱莉亚;付焕建

中国医学科学院中国协和医科大学药物研究所,北京100050; **School of Pharmacy, Virginia Commonwealth University, Richmond, VA, USA

摘要:

报道了22个苯甲酰胺类衍生物的合成,其中大多数化合物有不同程度的扩血管活性,化合物H_{1,11,17},E_{1,3}对去甲肾上腺素[NE](10⁻⁷ mol·L⁻¹)引起的大鼠主动脉条收缩的抑制作用明显优于先导物N-(4-甲氧基苯甲酰基)-N'-肉桂基哌嗪,化合物H_{7,15},E₇对85.7mmol·L⁻¹ KCl引起的大鼠主动脉条收缩有明显的抑制作用,进一步钾通道实验表明E₁可能为ATP敏感型钾通道开放剂。并初步分析了此类化合物的构效关系。

关键词: 苯甲酰胺 扩血管活性 构效关系

SYNTHESIS AND VASODILATIVE ACTIVITIES OF BENZAMIDE DERIVATIVES

He Xin; Lin Ziyun; Zhu Liya and Fu Huanjian

Abstract:

Twenty two benzamide derivatives were synthesized of which twenty one were not reported before. Vasodilative activity screening *in vitro* has shown that most of the compounds possess various activities, among which compound H₁, H₁₁, H₁₇, E₁, E₃ demonstrated a superior pharmacological profile to the lead compound when inhibiting effect on the noradrenaline (10⁻⁷ mol·L⁻¹) induced contraction of rat aortic strip was chosen as the evaluation criterion, while H_{7,15}, E₇ exerted significant inhibiting action toward 85.7 mmol·L⁻¹ KCl induced contraction of rat aortic strip. Further evaluation assays for their KCO potentials showed that E₁ might be an ATP sensitive KCO. Preliminary structure activity relationships of this kind of aromatic amides are discussed herein.

Keywords: Vasodilativeactivity Structure activity relationships Benzamide

收稿日期 1997-07-18 修回日期 网络版发布日期

DOI:

基金项目:

通讯作者: 朱莉亚

作者简介:

参考文献:

本刊中的类似文章

1. 陈关;潘启超.3-氨基苯甲酰胺增强平阳霉素的抗癌作用[J]. 药学报, 1985,20(5): 331-333
2. 褚国华;周启霆.苯甲酰胺类抗精神病药物的研究:若干3 α -去甲托品烷衍生物的合成[J]. 药学报, 1994,29(2): 149-152
3. 褚国华;周启霆.苯甲酰胺类抗精神病药物的研究:6 β -羟基,乙酰氧基和苯甲酰氧基-3 α 及 β -托品烷衍生物的合成[J]. 药学报, 1994,29(3): 185-194
4. 陈光旭;郭荣昆.长春胺中间体——1—乙基六氢吡(口朶)啉的合成[J]. 药学报, 1983,18(7): 507-513
5. 冯娟;解鹏;翁志洁;闫征;王楠;李建其.N-取代苯甲酰胺类衍生物的合成与抗肿瘤活性[J]. 药学报, 2009,44(6): 603-608

扩展功能

本文信息

- Supporting info
- PDF(1126KB)
- [HTML全文]
- 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

- 苯甲酰胺
- 扩血管活性
- 构效关系

本文作者相关文章

- 何欣
- 林紫云
- 朱莉亚
- 付焕建

PubMed

- Article by
- Article by
- Article by
- Article by

文章评论 (请注意:本站实行文责自负, 请不要发表与学术无关的内容!评论内容不代表本站观点.)

反馈人	<input type="text"/>	邮箱地址	<input type="text"/>
反馈标题	<input type="text"/>	验证码	<input type="text"/> 6701

Copyright 2008 by 药学报