

论文

美西律衍生物对 α_1 肾上腺素受体的作用

宋武;张义军;夏霖;刘国卿

中国药科大学药理教研室; *山东潍坊医学院药理教研室; **有机化学教研室, 南京210009

摘要:

为寻找新的 α_1 受体阻断剂,用 $[^3\text{H}]$ -WB4101配体测定法测定了18种美西律衍生物。结果表明,其中6种化合物对大鼠脑皮层 α_1 受体有不同程度的亲和力。凡具有手性碳结构的化合物亲和力都较高。化合物M-85001的亲和力较妥拉唑林(tolazoline)高一个数量级并能抑制苯肾上腺素引起的大鼠肛尾肌收缩,其 pA_2 (6.86)与 pK_i (6.51)相近。结果提示,美西律衍生物对 α_1 -受体的亲和力可能与手性碳结构有关,从美西律衍生物中研制新的 α_1 -受体阻断剂是有前途的。

关键词: α_1 -受体阻断剂 美西律衍生物 放射配体结合法

EFFECTS OF SOME MEXILETINE DERIVATIVES ON ALPHA $_1$ -ADRENOCEPTORS

Song WuSong W; Zhang Yijun; Xia LinXia L and Liu GuoqingLiu GQ

Abstract:

Using $[^3\text{H}]$ -WB 4101 binding assay in rat cerebral cortex membranes, effects of 18 mexiletine derivatives on alpha $_1$ -adrenoceptors were studied in order to find new antihypertensive alpha $_1$ receptor blocking agents. The results showed that 6 of them showed significant affinities to alpha $_1$ -adrenoceptors in rat cerebral cortex membranes. Some structure activity relationship were found, among them only the compounds with chiral carbon showed high affinity to alpha $_1$ -adrenoceptor. The affinity of compound M-85001($pK_i=6.51$)was shown to be higher than that of tolazoline. In the rat anococcygeal muscle, compound M-85001 competitively antagonized phenylephrine induced contraction with pA_2 value of 6.86 which is similar to its pK_i value in the binding assay. These findings may be of significance in the search for novel class of α_1 receptor antagonists.

Keywords: Mexiletine derivatives Radioligand binding assay Alpha $_1$ -adrenoceptor blocking agent

收稿日期 1997-03-24 修回日期 网络版发布日期

DOI:

基金项目:

通讯作者:

作者简介:

参考文献:

本刊中的类似文章

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.)

扩展功能

本文信息

- Supporting info
- PDF(532KB)
- [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

- α_1 -受体阻断剂
- 美西律衍生物
- 放射配体结合法

本文作者相关文章

- 宋武
- 张义军
- 夏霖
- 刘国卿

PubMed

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

反馈人	<input type="text"/>	邮箱地址	<input type="text"/>
反			

馈
标
题

验证码

2095