

论文

雌三醇11位取代物的合成

李继松;李振肃

北京医学院药理学系药物化学教研室; **1980~1982年研究生

摘要:

为了寻找新的雌激素类药物,合成了(11),(14a)~(14d)等五个雌三醇的11位取代物(11 α -OH,11 β -OH,11 α -OCH₃,11 β -OCH₃,11 β -OAc)供药理筛选。化合物的制备采用了新的合成路线;对 $\Delta^9(11)$ -雌酚酮缩酮物(3)及11位取代雌酚酮烯醇酯化合物(10a),(10b)的硼氢化反应进行了考察,分离得到了9 α -羟基物(5)及11位取代的16表雌三醇(13a)、(13b)等副产物。所有化合物的结构均通过光谱解析和化学转换得以确证。

关键词: 雌激素 11位取代的雌三醇 硼氢化反应 烯醇酯

SYNTHESIS OF 11-SUBSTITUTED ESTRIOL

Li Ji-Song and Li Zhen-Su

Abstract:

In a search for new estrogenic drugs, the 11-substituted estriols (11 α -OH, 11 α -OCH₃, 11 β -OH, 11 β -OCH₃ and 11 β -OAc) were synthesised. A novel process for their preparations was described. The structure of synthetic compounds were confirmed by chemical transformation and spectral analysis. The hydroboration of the 9(11)-dehydroestrone-3-ether-17-ketal (3) and the enol acetates of 11-substituted estrone 3-ether (10a), (10b) were investigated. The by-products 17-ketalized 9 α -hydroxy-estrone 3-ether (5) and 16-epi-11-substituted estriol 3-ether (13a), (13b) were obtained.

Keywords: 11-Substituted estriol Hydroboration Enol acetate Estrogen

收稿日期 1984-01-09 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

1. 陈立敏;吕秋军;Satoshi;Inoue;卞广兴;陈振花;温利青.基于报告基因的雌激素受体 β 亚型激动剂细胞筛选模型的建立[J]. 药学学报, 2006,41(8): 721-726
2. 王迺功;关慕贞;李和平;雷海鹏.醋酸棉酚和15甲基PGF_{2 α} 甲酯对大鼠子宫胞浆雌激素受体的影响[J]. 药学学报, 1987,22(2): 103-106
3. 郑虎;翁玲玲;王钢立;邓力.高分子载体药物的研究:聚乙二醇-雌激素类化合物的合成[J]. 药学学报, 1987,22(8): 637-640
4. 王迺功;李和平;张均田.雌酮和16,17-吡唑雌酮对大鼠子宫雌激素受体的作用[J]. 药学学报, 1986,21(2): 98-101
5. 莫正纪;焦秀香;苏怀德;郑虎;翁玲玲.骨靶向新化合物四环素 哌嗪雌酚酮的雌激素活性测定[J]. 药学学报, 1998,33(9): 645-649
6. 孙兰;汪青;刘景生.雌激素促进人的类成骨细胞TE85成骨作用的受体机制[J]. 药学学报, 1999,34(8): 561-564
7. 孙兰;胡静;郑虎;刘景生.在人的类成骨细胞TE85中雌激素对活性维生素D作用的影响[J]. 药学学报, 2000,35

扩展功能

本文信息

- Supporting info
- PDF(363KB)
- [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

- 雌激素
- 11位取代的雌三醇
- 硼氢化反应
- 烯醇酯

本文作者相关文章

- 李继松
- 李振肃

PubMed

- Article by
- Article by

(6): 413-416

8. 徐志斌;杨靖华.选择性雌激素受体调节剂的研究进展[J]. 药学学报, 2000,35(7): 547-551
9. 孙哲;吕秋军;温利青;郭绍明;陈媛媛;刘卫京.基于报告基因的雌激素受体 α 亚型配体筛选模型的建立和应用[J]. 药学学报, 2000,35(10): 747-751
10. 徐柏玲;郭宗儒;梁晓天;褚凤鸣;王乃功;关慕贞;.含有脂环的三苯乙烯化合物的合成和抗雌激素受体活性的研究[J]. 药学学报, 2001,36(3): 179-184
11. 李青南;翁玲玲;黄连芳;胡彬;陈槐卿;郑虎.哌嗪雌酚酮对去卵巢大鼠骨代谢的作用[J]. 药学学报, 2003,38(3): 161-164
12. 董曾寿;甘贵之;李鲁;汤仲明.雌二醇-3,17-取代物的合成和性能[J]. 药学学报, 1992,27(3): 236-240
13. 毛峰;翁玲玲;郑虎.乳腺癌组织内雌激素受体新检测试剂的合成[J]. 药学学报, 1991,26(8): 611-614
14. 王迺功;关慕贞;雷海鹏.月橘烯碱抗着床作用及其激素活性的研究[J]. 药学学报, 1990,25(2): 85-89
15. 李振肃;谭家镒;马成禹.雌二醇11位含氧取代物的合成[J]. 药学学报, 1983,18(7): 501-506
16. 王淑静;沈季铭;周维善.抗雌激素 Δ^4 -10 β -乙酰氧基-17 β -羟基-17 α -乙炔基-雌甾烯-3-酮的合成[J]. 药学学报, 1982,17(4): 302-304
17. 刘睿婷 吕秋军.抗阿尔茨海默病的多靶向药物研究进展[J]. 药学学报, 2009,44(3): 258-263

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"/> 9792