



“含哌嗪环的一枝蒿酮酸酯类衍生物及其制备方法”获发明专利

文章来源: 新疆理化技术研究所

发布时间: 2013-05-09

【字号: 小 中 大】

近日, 由中科院新疆理化技术研究所阿吉艾克拜尔·艾萨等科研人员完成的“含哌嗪环的一枝蒿酮酸酯类衍生物及其制备方法”获得国家发明专利授权(专利号: ZL 201010227465.2)。

菊科植物新疆一枝蒿(*Artemisia rupestris* L.)在新疆民间用药历史悠久, 具有抗炎、抗过敏、抗菌、抗癌、增强免疫力、解蛇毒、保肝、抗氧化等活性。哌嗪环是药物化学研究中常用的一类碱性基团, 较难发生亲电取代反应, 但对亲核试剂比较活泼, 其中2个N原子上的活泼氢均可被亲核试剂所取代; 同时哌嗪环具有毒性小, 易形成多个氢键或离子键, 可以有效地调节药物的脂水分配系数和酸碱平衡常数, 能有效地增加分子的碱性和水溶性等特点, 因此, 在许多药物的设计和开发中经常会引入哌嗪基团。

此项发明公开了一种含哌嗪环的一枝蒿酮酸酯类衍生物及其制备方法, 该类衍生物是以一枝蒿酮酸和1, ω -二溴代烃为原料, 在催化剂四丁基溴化铵的作用下合成中间体 ω -溴烷氧基一枝蒿酮酸酯类衍生物2a-2g; 衍生物2a-2g在无水碳酸钾的作用下, 乙腈为溶剂, 与1-甲基哌嗪反应后得到 ω -(4-甲基哌嗪基)-烷氧基一枝蒿酮酸酯类衍生物3a-3g; 或将衍生物2a-2g与1-苯基哌嗪反应后得到 ω -(4-苯基哌嗪基)-烷氧基一枝蒿酮酸酯类衍生物4a-4g。科研人员对所合成的衍生物进行了体外抗甲型H3N2, H1N1和乙型流感病毒活性测试, 结果表明: 化合物2g对甲型H1N1流感病毒有较好的抑制作用, 化合物3c, 3d, 3g, 4g对甲型H3N2, H1N1流感病毒有较好的抑制作用, 化合物3d对乙型流感病毒有较好的抑制作用。通过该方法制备的一枝蒿酮酸酯类衍生物可用于作为治疗抗甲型或乙型流感病毒药物的用途。

打印本页

关闭本页