

[本期目录] [下期目录] [过刊浏览] [高级检索]

[打印本页] [关闭]

论文

一些吲哚二酮类衍生物的合成及对AHAS的抑制活性

谭海忠, 李慧东, 王建国, 李文明, 李永红, 李正名

南开大学元素有机化学研究所, 元素有机化学国家重点实验室, 天津 300071

摘要:

基于一些新结构特征的AHAS抑制剂, 设计并合成了一系列吲哚二酮类化合物。初步的生物活性测试结果表明, 所合成的化合物在体内和体外均具有一定的生物活性, 其中, 化合物13在100 μg/mL浓度下对AHAS的抑制达到85%, 化合物7(平皿法)在100 μg/mL浓度条件下对油菜胚根生长抑制率可达84.7%, 是一类未见文献报道的结构新型的AHAS抑制剂, 有望为进一步设计合成更高活性的化合物提供参考。

关键词: 新型AHAS抑制剂 吲哚二酮类化合物 生物活性

Synthesis of Isatin Derivatives and Their Inhibition Against AHAS

TAN Hai-Zhong, LI Hui-Dong, WANG Jian-Guo*, LI Wen-Ming, LI Yong-Hong, LI Zheng-Ming*

State Key Laboratory of Elemento-Organic Chemistry, Elemento-Organic Chemistry Institute, Nankai University, Tianjin 300071, China

Abstract:

Based on the crystal structure of AHAS enzyme, bio-rational drug design was used to discover some novel AHAS inhibitors *via* computational virtual screening. Some isatin derivatives as AHAS inhibitors were designed, synthesized and evaluated. The preliminary results show that the isatin compounds exhibit considerable inhibition both *in vivo* and *in vitro* against AHAS. Compound 13 shows an inhibition of 85% at 100 μg/mL concentration *in vitro* and compound 7 shows an inhibition of 84.7% of rape root length at 100 μg/mL concentration. This discovery provides meaningful information for further design and synthesis of novel compounds with enhanced activity.

Keywords: Novel AHAS inhibitor Isatin derivatives Biological activity

扩展功能

本文信息

Supporting info

PDF(189KB)

[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

► 新型AHAS抑制剂

► 吲哚二酮类化合物

► 生物活性

本文作者相关文章

► 谭海忠

► 李慧东

► 王建国

► 李文明

► 李永红

► 李正名

► 谭海忠

► 李慧东

► 王建国

► 李文明

► 李永红

► 李正名

PubMed

Article by

基金项目:

通讯作者: 王建国, 李正名

作者简介:

参考文献:

1. Duggleby R. G., Pang S. S.. J. Biochem. Molec. Biol.[J], 2000, 33: 1—36
2. CUI Hai-Lan(崔海兰), TAO Ling-Mei(陶岭梅), LIU Xue(刘学), et al.. Pesticide Science and Administration(农药科学与管理)[J], 2007, 28(10): 47—52
3. XIAO Yong-Jun(肖勇军), WANG Jian-Guo(王建国), LI Zheng-Ming(李正名), et al.. Chem. J. Chinese Universities(高等学校化学学报)[J], 2007, 28(7): 1280—1282
4. WANG Jian-Guo(王建国), XIAO Yong-Jun(肖勇军), LI Zheng-Ming(李正名), et al.. Bioorg. Med. Chem.[J], 2007, 15: 374—380
5. Milind R., Frank D. P.. J. Med. Chem.[J], 1988, 31: 1001—1005
6. Vincent L., Max R., Sylvain R.. J. Org. Chem.[J], 2000, 65: 4193—4194
7. LI Wen(李雯), YOU Qi-Dong(尤启冬). Journal of Zhengzhou University(郑州大学学报)[J], 2004, 25(3): 29—32
8. Kara L. V., Julie M. L., Marie R., et al.. Bioorg. Med. Chem.[J], 2007, 15: 931—938
9. LI Zai-Guo(李在国), WANG Qing-Min(汪清民), HUANG Jun-Min(黄君珉). Organic Intermediate Preparation, 2nd Edition(有机中间体制备)[M], Beijing: Chemical Industry Press, 2001: 99, 105
10. Michael C. P., Sunil V. P., Koushik D. S., et al.. J. Med. Chem.[J], 2005, 48: 3045—3050
11. Wang B. L., Duggleby R. G., Li Z. M., et al.. Pest. Manag. Sci.[J], 2005, 61: 407—412
12. Singh B. K., Stidham M. A., Shaner D. L.. Anal. Biochem.[J], 1988, 171: 173—179
13. Wenkert E., Hudlicky T.. Synth. Commun.[J], 1977, 7: 541—547
14. Zhungietu G. I.. Chem. Heterocycl. Compd.(Engl. Transl.)[J], 1977, 13: 518—521
15. Holt S.. Proc. R. Soc. London B.[J], 1958, 148: 481—488
16. Cragoe E. J., Charles M. R., Mark D. B.. J. Org. Chem.[J], 1953, 18: 552—553
17. Cassebaum H.. J. Prakt. Chem.[J], 1964, 23: 301—308

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 . α -芳氧基乙酸-(2-取代氨基)-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 . β -榄香烯-TEG-Re(CO)₃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 .新型胍基葡萄糖昔的合成及生物活性[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- β -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. 孙小军, 苏娜, 刘幸海, 董卫莉, 李正名, 赵卫光.含4-噻唑啉酮环的新烟碱类化合物的合成及生物活性[J]. 高等学校化学学报, 2008,29(7): 1359-1362
15. 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
16. 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

17. 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
18. 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
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

文章评论

序号	时间	反馈人	邮箱	标题	内容
				ugg online ugg bo	
				online buy ugg boot	
				boots sale ugg boc	
				cardy ugg boots l	
				cardy tall ugg ugg	
				boots ugg knightsb	

Copyright 2008 by 高等学校化学学报