药学学报 2007, 42(1) 54-57 DOI: ISSN: CN:

论文

3-(4-哌嗪-1-苯基)-6-取代-*s*-三唑并［3,4-b］［1,3,4］噻二唑盐酸盐的合成及抗菌活性

胡国强;孙茂峰;谢松强;黄文龙;张惠斌

1. 河南大学 药物研究所, 河南 开封 475001; 2. 中国药科大学 新药中心， 江苏 南京 210009

摘要：

为了研究水溶性稠杂环化合物的合成方法及抗菌活性，本研究采用3-(4-氯苯基)-6-取代-*s*-三唑并［3,4-b］［1,3,4］噻二唑(2a～n)在相转移催化剂TBAI作用下与哌嗪发生亲核取代，再与盐酸成盐制备了3-(4-哌嗪-1-苯基)-6-取代-*s*-三唑［3,4-b］［1,3,4］噻二唑盐酸盐(3a～n)。用试管二倍稀释法研究了新化合物的体外抗菌活性。结果表明，合成的28个新化合物极性碱性哌嗪基的引入可提高化合物的抗菌活性。该类稠杂环化合物的结构有待进一步优化。

关键词： 相转移催化剂 均三唑并噻二唑 抗菌活性

Synthesis and antibacterial activity of 3-(4-piperazin-1-yl-phenyl)-*s*-triazolo［3,4-b］［1,3,4］thiadiazole hydrochlorides

HU Guo-qiang; SUN Mao-feng; XIE Song-qiang; HUANG Wen-long; ZHANG Hui-bin

Abstract:

To study the synthetic method and antibacterial activity of water-soluble fused heterocyclic compounds containing piperazine group, the nucleophilic substitution of 3-(4-chlorophenyl)-6-substituted-*s*-triazolo-［3,4-b］［1,3,4］thiadiazoles (2a-n) with piperazine in the presence of phase transfer catalyst TBAI afforded 3-(4-piperazin-1-yl-phenyl)-6-substituted-*s*-triazolo［3,4-b］［1,3,4］thiadiazole and then followed by acid treatment afforded 3-(4-piperazin-1-yl-phenyl)-6-substituted-*s*-triazolo［3,4-b］［1,3,4］thiadiazole hydrochlorides (3a-n). Twenty-eight new compounds were synthesized and their structures were confirmed by IR, ^{1}H NMR, MS and element analysis. The *in vitro* antibacterial activities of all newly synthesized compounds were tested against Gram positive bacteria and Gram negative bacteria with the standard 2-fold agar dilution method. Fourteen title compounds exhibited potential antibacterial activities *in vitro*. The structures of these compounds needed to be further optimized.

Keywords: *s*-triazolo［3,4-b］［1,3,4］thiadiazole antibacterial activity phase transfer catalyst

收稿日期 2006-06-26 修回日期 网络版发布日期

DOI:

基金项目:

通讯作者: 胡国强

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.)

反馈人		邮箱地址	

扩展功能
本文信息
Supporting info
PDF(123KB)
[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
相转移催化剂
均三唑并噻二唑
抗菌活性
本文作者相关文章
胡国强
孙茂峰
谢松强
黄文龙
张惠斌
PubMed
Article by
Article by
Article by
Article by
Article by

反馈标题		验证码	3617

Copyright 2008 by 药学学报