

论文

疟原虫组织期裂殖体杀灭剂4-甲基-5-(对-氟苯氧基)伯氨喹类似物的合成

陈昌;郭惠珠;冯智慧;郑贤育

中国预防医学科学院寄生虫病研究所,上海

摘要:

关键词: 疟原虫 组织期裂殖体杀灭剂 约氏疟原虫

SYNTHESIS OF ANALOGUES OF 4-METHYL-5(P-FLUOROPHENOXY)-PRIMAQUINE AS A TISSUE SCHIZONTICIDE OF MALARIA PARASITE

CHEN Chang; GUO Hui-Zhu; FENG Zhi-Hui and ZHENG Xian-Yu

Abstract:

A series of analogues of 4-methyl-5-(p-fluorophenoxy)-primaquine have been prepared for evaluating of tissue schizonticidal activity of Plasmodium yoelii in mice. 2-Bromo-4-acetamino-5-nitroanisole was reacted with pfluorophenol in the presence of potassium hydroxide to give 2-(p-fluorophenoxy) 4-acetamino-5-nitroanisole, which was subsequently hydrolyzed to yield corresponding amino compound. Cyclization of the amino compound with methyl vinyl ketone afforded 4-methyl-5-(p-fluorophenoxy)-6-methoxy-8-nitroquinoline. This product was reduced by iron and acetic acid to give corresponding 8-aminoquinoline. The latter was condensed with bromoalkylphthalimides to yield 4-methyl-5-(pfluorophenoxy)-6-methoxy-8-(1-phthalimidoalkyl) aminoquinolines (IV1~IV7). These compounds were heated with hydrazine hydrate to form 4-methyl-5-(p-fluorophenoxy)-6-methoxy-8-(1-aminoalkyl) aminoquinolines (IV8~IV13), and 4-methyl-5-(p-fluorophenoxy) primaquine (II). Compound II synthesized was radical curative at 10 mg/kgx1, while the analogues IV9 and IV10 were radical curative at 100 mg/kgx1 against P. yoelii in mice.

Keywords: Tissue schizonticide Plasmodium yoelii Malaria parasite

收稿日期 1985-11-21 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. 黄文洲;罗曼珍;周铭贤;潘星清. 酮替芬治疗猴疟的研究[J]. 药学报, 1987,22(6): 409-412
2. 李成韶;杜以兰;姜齐. 伯氏疟原虫对青蒿素抗药性的研究[J]. 药学报, 1986,21(11): 811-815
3. 林培英;潘竞骅;冯昭明. 蒿甲醚对小鼠血清IgG及脾重的影响[J]. 药学报, 1985,20(3): 211-213
4. 李高德. 伯氏疟原虫K173株对喹派抗药性的实验研究[J]. 药学报, 1985,20(6): 412-417
5. 李成韶;杜以兰;张翠莲;赵新静. 双氢青蒿素对小鼠抗疟作用的药效动力学[J]. 药学报, 1989,24(7): 487-489
6. 郑贤育;陈昌;房文. 疟原虫组织期裂殖体杀灭剂的研究:5-三氟乙酰基伯氨喹及其衍生物的合成[J]. 药学报, 1992,27(6): 423-427

扩展功能

本文信息

- Supporting info
PDF(212KB)
[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

- 疟原虫
组织期裂殖体杀灭剂
约氏疟原虫

本文作者相关文章

- 陈昌
郭惠珠
冯智慧
郑贤育

PubMed

- Article by
Article by
Article by
Article by

7. 邓蓉仙;钟景星;赵德昌;张洪北;盛杏英;丁德本;杨俊德. 茚甲醇类化合物的合成及抗疟作用[J]. 药学学报, 1997,32(11): 874-878
8. 陈昌;郑贤育;郭惠珠. 疟原虫组织期裂殖体杀灭剂的研究: 2-取代苯氧基和4-甲基伯氨喹以及喹啉类衍生物的合成[J]. 药学学报, 1992,27(6): 418-422
9. 周义清;李国福;钟景星;董正福;高徐生. 2,4-二氨基-6-取代氨基磺酰喹啉类化合物抗鼠疟作用的研究[J]. 药学学报, 1984,19(4): 245-250
10. 李成韶;杜以兰. 根据青蒿素药效半衰期制订给药方案的探讨[J]. 药学学报, 1984,19(6): 410-414
11. 陈林;郭凤川;戴祖瑞;李从军. 伯氏疟原虫ANKA株模型的建立及其在抗疟药筛选中的应用[J]. 药学学报, 1984,19(10): 732-736
12. 戴祖瑞;陈林;李裕棠;龚建章. 食蟹猴疟原虫——斯氏按蚊系统猴疟模型的一些生物学特性和对常用抗疟药物的生物效应[J]. 药学学报, 1983,18(12): 881-886
13. 管惟滨;黄文锦;周元昌;龚建章. 体外微量测定抗疟药药效的方法[J]. 药学学报, 1982,17(2): 139-142
14. 邵葆若;叶秀玉;郑浩. 伯氏鼠疟原虫(*Plasmodium berghei*)对咯萘啶抗药性的研究[J]. 药学学报, 1982,17(8): 566-571
15. 朱定球;戴祖瑞;李进才;蒋增康. 长效抗疟药—喹哌防治鼠疟的实验研究[J]. 药学学报, 1982,17(12): 894-898

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 style="width: 95%;" type="text"/>	邮箱地址	<input style="width: 95%;" type="text"/>
反 馈 标 题	<input style="width: 95%;" type="text"/>	验证码	<input style="width: 60%;" type="text"/> 2995