

论文

紫杉醇类似物的合成及抗肿瘤活性

要芬梅;郭积玉;梁晓天

中国医学科学院中国协和医科大学药物研究所,北京100050

摘要:

Sinenxan A(SIA)为生物合成法得到的新紫杉烷化合物。为寻找有抗肿瘤活性的新型taxol类似物,对SIA进行结构修饰.设计合成了10个化合物,在母核中引入四氢呋喃环,在14β-位或10β-位连接taxol/taxotere侧链,部分化合物显示一定的抗肿瘤活性。并讨论了这类化合物的构效关系。

关键词: 抗肿瘤活性 紫杉醇

SYNTHESIS AND CYTOTOXICITY OF THE NEW TAXOIDS

Yao Fenmei; Guo Jiyu and Liang Xiaotian

Abstract:

Sinenxan A is a new biosynthetic taxane. In order to search for new taxol analogues with cytotoxicity, sinenxan A was modified and studied.Ten new taxoids containing the tetrahydrofuran ring were esterified at C₁₄ or C₁₀ positions with taxol/taxotere side chain. Preliminary pharmacological tests showed that some of the compounds have certain cytotoxicity on KB, HCT-8 and A₂₇₈₀. Meanwhile, the relationship between their structures and activity was discussed.

Keywords: Taxoids Sinenxan A Antitumor activity

收稿日期 1997-04-08 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. 王宾;潘显道;刘红岩;杨晶;吕昭云;赵敬华.硫代秋水仙碱衍生物的合成和抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 2006,41(11): 1057-1063
2. 张剑锋;魏东芝;周雄;江峰.甲氨蝶呤-聚乙二醇偶联物的合成及其体外抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 2007,42(6): 607-610
3. 曹胜利;蒋宇扬;冯玉萍;刘世英;高红核;张玫;万荣.4(3H)-唑啉酮衍生物的合成及体外抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 2007,42(7): 741-746
4. 梁侨丽;闵知大.地胆草倍半萜内酯化化合物的结构修饰[J]. 药学学报, 2007,42(11): 1159-1161
5. 胡国强;董秀丽;谢松强;黄文龙.含羧酸侧链葱醌缩氨基均三唑席夫碱衍生物的合成及抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 2008,43(1): 50-53
6. 周双生;张群英;秦凯;鲁传华;谢复新.三氮杂十环及其铂(II)配合物的合成以及抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 2008,43(5): 490-494
7. 胡国强;毋晓魁;王新;张智强;谢松强;黄文龙;张惠斌.氟喹诺酮C3杂环取代衍生物的合成及抗肿瘤活性研究(I):

扩展功能

本文信息

- ▶ Supporting info
- ▶ PDF(789KB)
- ▶ [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

- ▶ 抗肿瘤活性
- ▶ 紫杉醇

本文作者相关文章

- ▶ 要芬梅
- ▶ 郭积玉
- ▶ 梁晓天

PubMed

- ▶ Article by
- ▶ Article by
- ▶ Article by

8. 戈平;王哲清;张椿年. 柔红酮和阿霉酮二肽衍生物的合成[J]. 药化学报, 1987,22(4): 254-263
9. 高晓彦;顾学裘;陶钧. 环磷酸胺脂质体(CPL)重建型的制备、重建后CPL的特性及抑瘤作用的研究[J]. 药化学报, 1987,22(8): 612-618
10. 邹继纯;黄量. 中药青黛中几种微量成分的研究——I. 吡啶并[2,1b]喹唑啉-6,12-二酮和青黛酮的分离、结构鉴定及合成[J]. 药化学报, 1985,20(1): 44-51
11. 毛曼君;陈耀祖;田璋. 杂环化合物取代的5-氟尿嘧啶衍生物的合成及抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1998,33(5): 389-391
12. 鲁宽科;陈耀祖. 自旋标记的鬼臼葡萄糖苷衍生物的合成[J]. 药化学报, 1998,33(12): 948-950
13. 鲁宽科;陈耀祖. 4-S-(5"-炔基-4"-氨基-1",2",4"-三唑-3"-基)-4-去氧-4'-去甲基表鬼臼毒素衍生物的合成及抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1999,34(1): 63-66
14. 杨玉社;嵇汝运;陈凯先;丁健. 左旋氧氟沙星类似物的合成及其抗菌抗肿瘤活性研究[J]. 药化学报, 1999,34(2): 119-124
15. 张虎翼;张铭龙;朴志松;马灵台;张礼和. 3-(R)-(碱基)-4-(S)-羟基-5-(R)-羟亚甲基四氢呋喃的合成及抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1999,34(5): 363-367
16. 刘捷;徐莉;徐世平. 3-(取代苯基乙烯基)吡啶类衍生物的合成及抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1999,34(12): 908-912
17. 陈再新;马维勇;王金娣;陈秀华;张椿年. 4-β-酯取代-4-脱氧-4'-去甲基表鬼臼毒素衍生物的合成及其抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 2000,35(5): 353-357
18. 刘小云;刘秀均;李毅;王维刚;甄永苏. 平阳霉素与单克隆抗体Fab'片段偶联物的抗肿瘤作用[J]. 药化学报, 2000,35(9): 649-653
19. 郭保国;葛泽梅;程铁明;李润涛;. 1,4-二 [3-(氨基硫代甲酰硫基)丙酰基] 哌嗪类化合物的合成及其抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 2001,36(3): 185-187
20. 徐嵩;徐世平;李兰敏;. 取代4-苯乙烯基香豆素的合成及其抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 2001,36(4): 269-273
21. 李洪燕;李燕;刘忠海;吴亨佳;陈飞虎;陈晓光. 重组人内抑素的抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 2002,37(10): 763-766
22. 陈虹;陈若芸;于德泉. P-甲基-哥纳三醇衍生物的合成及体外抑制肿瘤细胞活性[J]. 药化学报, 2002,37(10): 775-780
23. 张莹;吴立军;田代真一;小野寺敏;池岛乔. 吴茱萸碱诱导人黑色素瘤A375-S2细胞的两种死亡机制吴茱萸碱诱导人黑色素瘤A375-S2细胞的两种死亡机制[J]. 药化学报, 2003,38(9): 650-653
24. 潘显道;王存英. 天然抗肿瘤药喜树碱衍生物的研究进展[J]. 药化学报, 2003,38(9): 715-720
25. 阮继武;黄金凤;符立梧;黄志纾;马林;古练权. 多芳基取代蝶啶类化合物的合成及其抗肿瘤活性多芳基取代蝶啶类化合物的合成及其抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 2004,39(5): 342-347
26. 潘显道;刘红岩;孙飘扬;朱承根;杨晶;袁开红;韩锐. 20-位酯化喜树碱衍生物的合成和抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 2004,39(8): 591-597
27. 蒙小英;张秀平;陈秀华;余爱珍. 2,4-二氨基-5-甲基-6-(N-甲基取代苄氨基)喹唑啉的合成及其抗肿瘤和抗菌作用[J]. 药化学报, 1991,26(5): 383-386
28. 邵荣光;甄永苏. 新抗癌抗生素C1027及其单克隆抗体组装偶联物的抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1992,27(7): 486-491
29. 尹大力;徐承熊;高由松;刘大宽;文赛玉;郭积玉. 海南新碱类似物的化学与抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1992,27(11): 824-829
30. 王志光;尹述凡;马维勇;李炳生;张椿年. 4-酰胺基-4-脱氧-4'-去甲基表鬼臼毒素衍生物的合成和抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1993,28(6): 422-427
31. 尹述凡;马维勇;王天都;陈秀华;张椿年. 4-(2-酰胺基-2-氧羰基)乙硫基-4-脱氧-4'-去甲基表鬼臼毒素衍生物的合成与抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1993,28(9): 668-672
32. 尹述凡;王志光;马维勇;陈秀华;王天都;张椿年. 4-O-卤代酰基-4'-去甲基表鬼臼毒素类似物的合成与抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1993,28(10): 758-761
33. 蒙小英;刘进前;张秀平;陈秀华;余爱珍;戴祖瑞. 2,4-二氨基-5-氟-6-取代苄氨基喹唑啉的合成及生物活性[J]. 药化学报, 1994,29(4): 261-267
34. 丁平羽;朱小祥;蔡孟深;于德泉. 升麻酰胺及其类似物的合成[J]. 药化学报, 1997,32(10): 755-760
35. 杨洪勤;蔡俊超. N-甲基-8,9-次甲二氧基-2-羧基氯化吡啶季铵盐的合成[J]. 药化学报, 1997,32(3): 233-235
36. 丁平羽;于德泉. 新疆藁本保肝有效成分类似物的合成研究[J]. 药化学报, 1996,31(11): 817-822
37. 钟三保;刘维勤;李仁利;凌仰之;李重华;涂光忠;马立斌;洪少良. 三尖杉酯类生物碱的半合成及结构与抗肿瘤活性的关系[J]. 药化学报, 1994,29(1): 33-38
38. 尹述凡;庄武;马维勇;王志光;王天都;陈秀华;张椿年. 4-S-(5-酰氨基-1,3,4-噻二唑-2-基)-4-脱氧-4'-去甲基表鬼臼毒素衍生物的合成与抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1993,28(10): 762-765
39. 王志光;马维勇;李炳生;张椿年. 4-烷硫基-4-脱氧-4'-去甲基表鬼臼毒素的合成和抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1992,27(9): 656-661
40. 刘进前;徐小岗;陈秀华;余爱珍;戴祖瑞;张秀平. 2,4-二氨基-5-氯-6-取代苄氨基喹唑啉类化合物的合成及其抗癌、抗肿瘤和抗菌活性[J]. 药化学报, 1991,26(11): 821-828
41. 姜凤超;马卫东;程仕才. β-锗代-α-氨基酸衍生物的合成及抗肿瘤活性[J]. 药化学报, 1992,27(2): 150-152

42. 王志光;庄武;尹述凡;马维勇;李柄生;张椿年.4-酰硫基-4-脱氧-4-去甲表鬼臼毒素衍生物的合成和抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 1992,27(5): 345-348
43. 陈未名;张佩玲;吴斌;郑启泰.云南红豆杉抗肿瘤活性成分的研究[J]. 药学学报, 1991,26(10): 747-754
44. 翟富民;尤启冬;王华;陈晓光;李燕;李洪燕.甲氧基吡啶类化合物的合成及其体外抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 2004,39(10): 808-812
45. 孔景临;杜秀宝;范崇旭;徐建富;郑晓军.一种槲寄生多肽的一级结构分析和抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 2004,39(10): 813-817
46. 夏明钰;王敏伟;王浩然;田代真一;池岛乔.血竭素高氯酸盐诱导人宫颈癌HeLa细胞凋亡的机制[J]. 药学学报, 2004,39(12): 966-970
47. 王海燕;蔡兵;崔承彬;张冬云;杨宝峰.蔓荆子活性成分vitexicarpin诱导K562细胞凋亡的机制[J]. 药学学报, 2005,40(1): 27-31
48. 李弟灶;王存英;潘显道;刘红岩;付招娣;吴松.六环喜树碱衍生物的合成与抗肿瘤活性研究[J]. 药学学报, 2005,40(3): 241-247
49. 程云锋;胡永洲;何俏军.咪唑啉-2-酮衍生物的合成及其抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 2005,40(8): 711-716
50. 赵翠花;陈奕;丁健;段文虎.喹啉衍生物的设计合成及抗肿瘤活性研究[J]. 药学学报, 2005,40(9): 814-819
51. 钟文远;胡智兴;陈顺方;纪舒昱;周轶平;李玛琳. $[\text{Ln}(\text{Phen})_2(5\text{-Fu})_3(\text{NO}_3)](\text{NO}_3)_2$ 的合成、表征及体外抗肿瘤活性研究[J]. 药学学报, 2005,40(11): 997-1000
52. 李茵;周慧君;.二氢青蒿素抑制K562细胞血管内皮生长因子的表达[J]. 药学学报, 2005,40(11): 1041-1045
53. 张奇;项光亚;龙娜;林佳亮;曾凡波.叶酸靶向的PGA联合N-苯乙酰化阿霉素的抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 2005,40(11): 1046-1050
54. 王哲清;冯大为;张椿年.柔红酮和阿霉酮氨基酸酯的合成[J]. 药学学报, 1984,19(5): 349-356
55. 张万年.8-三氮烯嘌呤类化合物的合成和抗肿瘤活性的研究[J]. 药学学报, 1982,17(12): 909-916
56. 冯娟;解鹏;翁志洁;闫征;王楠;李建其.N-取代苯甲酰胺类衍生物的合成与抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 2009,44(6): 603-608
57. 孔淑仪;唐国涛;裴元英;姜嫣嫣.PAMAM-PEG/甲氨蝶呤复合物在正常及荷瘤鼠体内的药动学和抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 2009,44(1): 85-90
58. 赵杰;曹胜利;郑晓霖;赵波.叶酸受体介导的抗肿瘤药物研究进展[J]. 药学学报, 2009,44(2): 109-114

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"/> 6592