

论文

吡酮酸类抗菌药物的研究XIV.7,8-双取代-1-环丙基-6-甲基-1,4-二氢-4-氧代喹啉-3-羧酸类化合物的合成与构效关系

王洪权;戚建军;孙兰英;余兰香;郭惠元

中国医学科学院中国协和医科大学医药生物技术研究所,北京100050

摘要:

合成了18个1-环丙基-6-甲基-7-取代氨基,8-位为H,Cl,NO₂,NH₂的6-位非氟吡酮酸类化合物,测定了它们对10株革兰氏阳性和革兰氏阴性细菌的MIC值,并与环丙沙星、诺氟沙星对照,讨论了它们的构效关系。

关键词: 吡酮酸 喹诺酮衍生物 抗菌活性 构效关系

STUDIES ON PYRIDONECARBOXYLIC ACIDS AS ANTIBACTERIAL AGENTS XIV. SYNTHESIS AND STRUCTURE-ACTIVITY RELATIONSHIPS OF 7,8-DISUBSTITUTED-1-CYCLOPROPYL-6-METHYL-1,4-DIHYDRO-4-OXO-3-QUINOLINE CARBOXYLIC ACIDS

Wang Hongquan; Qi Jianjun; Sun Lanying; Yu Lanxiang and Guo Huiyuan

Abstract:

Eighteen pyridonecarboxylic acids, characterized by a methyl group at the C₆-position instead of the usual fluorine atom, cyclopropyl at the N₁-position, substituted amino groups at the C₇-position, and some substituted groups (hydrogen, chlorine, nitro and amino) at the C₈-position, were synthesized. The *in vitro* antibacterial activity of these compounds were tested, and the structure-activity relationships were also discussed. The results of the study showed that the activity of compounds 22 and 24 were less potent than that of ciprofloxacin against *S.aureus*, *S.epidermidis*, *E.coli* and *P.aeruginosa*, while they were 2~100 times more potent than ciprofloxacin against *K.pneumoniae*, *S.marcescens*, *A.calcoaceticus*, *E.aerogenes*, *S.typhi* and *S.typhimurium*.

Keywords: Quinolone derivatives Antibacterial activity Structure activity relationship Pyridonecarboxylic acid

收稿日期 1997-08-22 修回日期 网络版发布日期

DOI:

基金项目:

通讯作者: 郭惠元

作者简介:

参考文献:

本刊中的类似文章

1. 郭惠元;汤云;李卓荣;阎桂华;张致平.吡酮酸类抗菌药物的研究——V.1-乙基-6-氟-1,4-二氢-4-氧-7-(4-甲基-1-哌嗪)喹啉-3-羧酸新戊酰氧甲酯及其类似物的合成与抗菌活性[J]. 药学报, 1987,22(5): 373-376
2. 叶发青;陈莉;黄金敏.含2-甲基-5-硝基咪唑的吡酮酸类衍生物的合成及其抗菌活性含2-甲基-5-硝基咪唑的吡酮酸类衍生物的合成及其抗菌活性[J]. 药学报, 2003,38(4): 260-263
3. 李向红;田治明;苗华;余兰香;郭惠元.吡酮酸类抗菌药物的研究 XII.6-氯-1-环丙基-7-(1-哌嗪基)-1,4-二氢-4-

扩展功能

本文信息

- ▶ Supporting info
- ▶ PDF(825KB)
- ▶ [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

- ▶ 吡酮酸
- ▶ 喹诺酮衍生物
- ▶ 抗菌活性
- ▶ 构效关系

本文作者相关文章

- ▶ 王洪权
- ▶ 戚建军
- ▶ 孙兰英
- ▶ 余兰香
- ▶ 郭惠元

PubMed

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

氧代喹啉-3-羧酸及其类似物的合成与抗菌作用[J]. 药学学报, 1997,32(11): 844-851

4. 陈建新;郭惠元.吡酮酸类抗菌药物的研究——X.1,7-双取代-6-氟-1,4-二氢-4-氧代喹啉-3-羧酸类化合物的合成与构效关系[J]. 药学学报, 1991,26(10): 733-740

5. 李卓荣;郭惠元;张致平.吡酮酸类抗菌药物的研究——IX.若干吡酮酸类化合物前药的研究[J]. 药学学报, 1991,26(2): 111-116

6. 郭惠元;孙兰英;汤云;阎桂华;张致平.吡酮酸类抗菌药物的研究——VI.7-氯-6-氟-1-乙基-1,4-二氢-4-氧吡啶(2,3-c)并吡嗪-3-羧酸及其衍生物的合成与抗菌活性[J]. 药学学报, 1988,23(8): 566-573

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"/> 7420