

论文

新3,5-二取代 唑烷酮抗菌剂的合成及其体外抑菌活性新3,5-二取代 唑烷酮抗菌剂的合成及其体外抑菌活性

孟庆国;王琪;刘浚

1.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; 2.北京大学 第一医院 临床药理研究所, 北京 100034

摘要:

目的设计、合成 唑烷酮新化合物并测定其体外抑菌活性。方法对文献方法进行了改进,在文献报道的构效关系基础上,设计、合成 唑烷酮新化合物并测定体外抑菌活性。结果合成了39个新化合物,其中目标物18个,其结构经IR,¹HNMR,MS等方法确证。16个化合物显示出较好的抑菌活性,其中化合物9, 10, 10b对4种试验菌的MIC50和 MIC90值小于或接近4种对照药,化合物9a和11c没有抑菌活性。结论化合物9, 10和10b值得进一步研究。

关键词: 唑烷酮 抑菌剂 合成 抑菌活性

Synthesis and *in vitro* antibacterial activities of new 3,5-disubstituted oxazolidinone compounds

MENG Qing-guo; WANG Qi; LIU Jun

Abstract:

AimTo design and synthesise new oxazolidinone antibacterial agents.MethodsThe synthetic method reported in literature has been modified and new 3,5-disubstituted oxazolidinone compounds were synthesized on the basis of SAR reported in the literature and their antibacterial activities *in vitro* were determined.ResultsEighteen new objective compounds were synthesized, and their structures were determined by IR, ¹HNMR and FAB-MS.Within the eighteen new objective compounds, sixteen compounds showed antibacterial activity *in vitro* and compound 9, 10 and 10b showed better antibacterial activities *in vitro* than ciprofloxacin (CIP), sultamicillin (Sul) and vancomycin (VCO). Compounds 9a and 11c have no antibacterial activity *in vitro* at all.ConclusionCompounds 9, 10 and 10b are worthy to be intensively studied.

Keywords: antibiotic synthesis antibacterial activity oxazolidinone

收稿日期 2002-10-24 修回日期 网络版发布日期

DOI:

基金项目:

通讯作者: 孟庆国

作者简介:

参考文献:

本刊中的类似文章

1. 张大永; 向华; 徐云根; 华维一. 2-芳亚胺基-4-噻唑烷酮类化合物的合成及生物活性[J]. 药学报, 2006,41(9): 825-829
2. 翟鑫; 张国刚; 缙东辉; 刘君鹏; 宫平. 新型噻唑烷酮类化合物5-位侧链的结构改造及抗菌活性[J]. 药学报, 2006,41(10): 985-989
3. 于慧杰; 周伟澄. 7-{4-[2-[2-取代-4-((5S)-5-乙酰胺甲基-2-氧代-噻唑烷-3-基)苯基]乙基]哌嗪-1-基}-氟喹诺酮类化合物的合成与抗菌活性[J]. 药学报, 2006,41(10): 990-999
4. 杜明慧; 凌仰之; 刘维勤; 库宝善; 刘红剑. 1-取代吡唑烷酮类抗惊厥构效关系的研究[J]. 药学报, 1988,23(9): 703-706
5. 刘菊芳; 裴印权; 王振东; 徐建国; 雷小平; 凌仰之. 吡唑烷酮类化合物的抗惊厥作用[J]. 药学报, 1994,29(3): 166-170

扩展功能

本文信息

- Supporting info
- PDF(158KB)
- [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

- 唑烷酮
- 抑菌剂
- 合成
- 抑菌活性

本文作者相关文章

- 孟庆国
- 王琪
- 刘浚

PubMed

- Article by
- Article by
- Article by

6. 全哲山;李仁利;凌仰之.5-取代-1-正丁基-3-吡唑烷酮类化合物的合成及抗惊作用的构效关系[J]. 药学学报, 1992,27(9): 711-716
7. 雷小平;栾燕;凌仰之;李仁利;裴印权.5-取代苯基,1-氢及1-正丙基吡唑烷酮-3化合物抗惊作用QASR的研究[J]. 药学学报, 1990,25(9): 684-688
8. 李荣坡;周伟澄;周伟良.(S)-5-乙酰胺甲基-3- [(4-取代胺甲基)苯基] -2-噁唑烷酮衍生物的合成及抗菌活性[J]. 药学学报, 2006,41(5): 418-425

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"/> 1328