

论文

缬(丙)-酪和缬-酪-酪肽类化合物的合成和生物活性

陈佩林;彭司勋;杨祯祥

中国药科大学药物化学研究室,南京210009

摘要:

以天然血管紧张素转化酶抑制剂(ACEI)I<sub>5</sub>B<sub>2</sub>,WF-10129为先导化合物,结合现有ACEI的结构特征,设计和合成了含缬-酪-酪(I<sub>1~4</sub>)和缬(丙)-酪(II<sub>1~6</sub>)肽类化合物。初步药理试验表明,II类化合物体外均有不同程度抑制ACE的活性,其中以II<sub>5</sub>活性最强(IC<sub>50</sub>=7.9×10<sup>-10</sup>mol/L),体内抑制血管紧张素I(AI)的升压活性也以II<sub>5</sub>和II<sub>4</sub>最强,与卡托普利相仿。

关键词: 血管紧张素转化酶抑制剂 缬-酪-酪肽类 缬(丙)-酪肽类 构效关系

SYNTHESIS AND BIOLOGICAL ACTIVITY OF SOME VAL(ALA)-TYR AND VAL-TYR-TYR PEPTIDES

PL Chen;SX Peng;ZX Yang

Abstract:

I5B2 and WF-10129, reported as potent angiotensin-converting enzyme inhibitors (ACEI), were used as lead compounds for design of novel ACEI. Some of Val-Tyr-Tyr and Val-Tyrpeptides were synthesized and tested for ability to inhibit ACE *in vitro* and *in Vivo*. The most potent compound was found to be N-(1-benzoyl-1-carboxymethyl)-L-Alanyl-L-Tyrosine (II<sub>5</sub>, IC<sub>50</sub>=7.9×10<sup>-10</sup>mol/L) which was prepared by the addition of Ala-Tyr to benzoylacrylic acid in the presence of triethylamine. The structure-activity relationships were also discussed.

Keywords: Val--Tyr--Tyr peptides Val (Ala)--Tyr peptides Structure--activity relationships Angiotensin--converting enzyme inhibitors

收稿日期 1991-08-23 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. 吴珉;谢美华;赵德元;陈光远;王毅诚;孔华.血管紧张素转化酶抑制剂——卡托普利酯类衍生物的合成和药理作用[J]. 药学报, 1988,23(12): 890-894
2. 陈佩林;杨祯祥;彭司勋.N-(2-巯基苯甲酰)-N-烷基/芳基甘氨酸及其双硫化物的合成[J]. 药学报, 1987,22(9): 662-670
3. 辛志宏;马海乐;吴守一;代春华.高效毛细管电泳测定血管紧张素转化酶抑制剂captopril的活性[J]. 药学报, 2003,38(11): 843-845
4. 陈耀明;蔡纯一;龚康孙.N-(4-乙氧羰基-4-取代丁酰基)-N-取代甘氨酸的合成[J]. 药学报, 1989,24(12): 887-894
5. 罗娅林;杨祯祥;彭司勋.N-(2-巯基吡啶-3-甲酰)-N-烃基甘氨酸及其双硫化物的合成[J]. 药学报, 1990,25(5): 374-378

扩展功能

本文信息

- ▶ Supporting info
- ▶ PDF(328KB)
- ▶ [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

- ▶ 血管紧张素转化酶抑制剂
- ▶ 缬-酪-酪肽类
- ▶ 缬(丙)-酪肽类
- ▶ 构效关系

本文作者相关文章

- ▶ 陈佩林
- ▶ 彭司勋
- ▶ 杨祯祥

PubMed

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

6. 江云; 龚康孙; 蔡纯一; 周群; 虞文. *N*-(2-甲氧羰基苯氧/硫乙酰基)-*N*-取代甘氨酸的合成[J]. 药学学报, 1995, 30(2): 150-156
7. 陈何如; 徐杰诚. 膦肽类化合物对血管紧张素转化酶的体外抑制活性及构效关系[J]. 药学学报, 1996, 31(9): 671-675
8. 林文清; 蔡纯一; 龚康孙; 吴; 勇; 龙; 翥; 罗晓星; 杨; 力; 李景峰; 姚秀娟. *N*-(4-甲氧羰基-4-邻苯二甲酰亚氨基丁酰基)-*N*-取代甘氨酸、脯氨酸和焦谷氨酸的合成[J]. 药学学报, 1994, 29(5): 346-354
9. 吴勇; 蔡纯一; 龚康孙. *N*-(4-取代氨基-4-氧代丁酰基)-*N*-取代甘氨酸的合成[J]. 药学学报, 1992, 27(9): 717-720

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" value="4440"/>