

论文

K-受体激动剂U-50488类似物的合成及其镇痛作用

马斯才;杨玉龙;袁小妹

南京军区南京总医院药物研究所,南京210002; \*中国人民解放军药物化学研究所, 北京102205

摘要:

本文报道了某些κ-型阿片受体激动剂U-50488结构类似物的合成。在小白鼠热板试验和扭体试验的结果表明,反式环己二胺结构中2位氨基为五元环吡咯啉基时对κ-活性有重要作用。以六元环氨基(哌啶基、哌嗪基、吗啉基)取代2位五元环氨基导致κ-活性降低。另外,也探讨了1位芳酰胺基结构改变对κ-活性的影响。

关键词: 镇痛活性 κ-受体激动剂 U-50488结构类似物

SYNTHESIS AND ANALGESIC ACTIVITY OF ANALOGS OF U-50488, AN OPIATE KAPPA-AGONIST

SC Ma; YL Yang and XM Yuan

Abstract:

In this paper, we report the synthesis and analgesic activities in mouse hot plate test and writhing test of some analogs of U- 50488, a κ-agonist. Results showed that compounds in which the amino group was pyrrolinyl had higher κ-agonist activity and the substitution of two chlorine atoms in 3 and 4-positions of the benzene nucleus was very important to κ-activity. Furthermore, all of compounds in which the amino group was piperidyl, piperazinyl or morpholinyl exhibited very weak κ-agonist activity.

Keywords: *Kappa*-receptor agonist Analogs of U- 50488 Analgesic activity

收稿日期 1990-12-17 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. 李建其;黄丽瑛;陈建新;翁志洁;张椿年.芳烷酮哌嗪衍生物的设计合成及镇痛活性[J]. 药学报, 2007,42(11): 1166-1175
2. 郭焕芳;周培岚;宫泽辉;谢蓝.邪蒿素及其衍生物的合成及镇痛活性[J]. 药学报, 2008,43(9): 930-933
3. 胡建国;李玉林;陈冀胜.4-取代芬太尼类化合物的晶体结构和构效关系[J]. 药学报, 1987,22(11): 864-868
4. 马斯才;陆苏南;李可中;王崇铨.3,4-二氯-N-甲基-N-[反式-2-(1- $\Delta^3$ -吡咯啉基)环己基]-苯乙酰胺盐酸盐的合成及其镇痛活性的研究[J]. 药学报, 1986,21(11): 861-863
5. 朱友成;吴吉安;徐修容.3-甲基芬太尼衍生物QSAR研究[J]. 药学报, 1985,20(4): 267-276
6. 丁平羽;李润涛;蔡孟深.双芬太尼类化合物的合成及镇痛活性研究[J]. 药学报, 1998,33(10): 737-740
7. 李润涛;崔家玲;程铁明;蔡孟深.二酰基双哌嗪双季铵盐类衍生物的合成及镇痛活性[J]. 药学报, 1999,34(9): 666-668

扩展功能

本文信息

- ▶ Supporting info
- ▶ PDF(129KB)
- ▶ [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

- ▶ 镇痛活性
- ▶ κ-受体激动剂
- ▶ U-50488结构类似物

本文作者相关文章

- ▶ 马斯才
- ▶ 杨玉龙
- ▶ 袁小妹

PubMed

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

8. 李瑞文;张奕华;季晖;于晓琳;彭司勋. 苯基吡唑氮氧化物与双氯芬酸偶联化合物的合成及其抗炎镇痛活性[J]. 药学学报, 2002,37(1): 27-32
9. 翁坚慧;徐修容;朱友成;周杰;徐珩;池志强. 3-甲基芬太尼衍生物构效关系及受体结合特征研究[J]. 药学学报, 1990,25(3): 178-185
10. 陈晓盼;杨玉龙;陈常英;商尔. 顺-3-甲基芬太尼的4-N-丙酰基结构类似物的合成与镇痛活性及构效关系的研究[J]. 药学学报, 1992,27(7): 503-509
11. 李润涛;曹胜利;陈恒昌;杨锦宗;蔡孟深. 1,1-二烷基-4-(3-溴丙酰基)-哌嗪溴化物的合成及生物活性研究[J]. 药学学报, 1996,31(10): 757-760
12. 戎锁宝;蒋华良;池志强;陈凯先;朱友成;嵇汝运. 3-甲基芬太尼衍生物立体异构体的 QSAR 研究[J]. 药学学报, 1997,32(6): 420-425
13. 王智贤;朱友成;陈新建;嵇汝运. 3-甲基芬太尼立体异构体的合成、绝对构型和镇痛活性[J]. 药学学报, 1993,28(12): 905-910
14. 朱国政;李云祥;颜松民. 3-甲基芬太尼衍生物的合成及镇痛活性[J]. 药学学报, 1990,25(11): 811-814
15. 卢志英;赵淑媛;袁小妹;杨玉龙. 4-甲氧羰基芬太尼的4-N-丙酰基结构类似物的合成与镇痛活性[J]. 药学学报, 1990,25(5): 336-339
16. 李润涛;蔡俊超;蔡孟深. 1-烷基-1-苄基-4-(3-氯-2-羟基)丙基哌嗪季铵盐的合成及生物活性[J]. 药学学报, 1998,33(1): 28-33
17. 朱友成;吴瑞琴;仇达萍;黄忠明;张鸿萍;池志强. 强效镇痛剂研究——VI. 顺-3-甲基芬太尼的4-N-丙酰基的结构改变与镇痛活性[J]. 药学学报, 1983,18(8): 591-596
18. 朱友成;吴瑞琴;仇达萍;黄忠明. 强效镇痛剂研究 VII. 1-β-羟基-3-甲基芬太尼(7302)及有关化合物非对映异构体的合成及镇痛活性[J]. 药学学报, 1983,18(12): 900-904
19. 王冠;张桂森;郭琳;陈洁;李建其. 芳烷基-4-哌啶醇衍生物的合成及非阿片类镇痛活性研究[J]. 药学学报, 2009,44(4): 371-378

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: 50%;" type="text"/> 4518