

论文

2,4-二氨基-5-氟-6-取代苄氨基喹唑啉的合成及生物活性

蒙小英;刘进前;张秀平;陈秀华;余爱珍;戴祖瑞

上海医药工业研究院,上海200437;*上海第二军医大学,上海200433

摘要:

本文报道2,4-二氨基-5-氟-6-取代苄氨基喹唑啉类化合物的合成及抗疟、抗肿瘤和抗菌活性,这类化合物的合成是由5-氟-2,4,6-三氨基喹唑啉(6a)与取代苯甲醛缩合成Schiff碱,然后经还原、甲酰化、亚硝化或甲基化制得。5-氟-2,4,6-三氨基喹唑啉(6a)尚未见文献报道,由5-氟-2,4-二氨基喹唑啉(4)经硝化生成异构体5a和5b分离得5a后再经还原制得。经对伯氏鼠疟原虫Plasmodium berghei抑制性治疗筛选,有6个化合物I_{2,4,5,6}和II_{5,6}以每日1mg·kg⁻¹给药4天,抑制率为100%;体外抗肿瘤活性以I₄最强,对L1210白血病细胞的IC₅₀为9.86×10⁻⁴μg·mL⁻¹,优于氨甲蝶呤(MTX);经对18种常见菌进行体外筛选,发现对肺炎双球菌Diplococcus pneumoniae活性较好。

关键词: 氨基喹唑啉 5-氟-2 6-三氨基喹唑啉 抗疟活性 抗肿瘤活性 抗菌活性

SYNTHESIS AND BIOLOGICAL ACTIVITIES OF 2,4-DIAMINO-5-FLUORO-6-SUBSTITUTED BENZYLAMINO QUI NAZOLINES

XY Meng;JQ Liu;XP Zhang;XH Chen;AZ Yu and ZR Dai

Abstract:

The title compounds were synthesized by condensation of 5-fluoro- 2,4,6-triaminoquinazoline(6a) with various substituted benzaldehydes to produce the corresponding Schiffbases, followed by reduction. I and III were obtained by formylation and nitrosation of I, respectively, IV were obtained by reduction of II. Primary screening for suppressive therapeutic effects against P. berghei mice showed that six of the twenty-two compounds produced 100%suppression when administered orally at dose of 1mg·kg⁻¹. All compounds exhibited potent activity against L₁₂₁₀ cell in vitro. Among them I₄ was more active than MTX. A number of compounds showed moderate activities against Diplococcus pneumoniae in in vitro tests.

Keywords: 5-Fluoro-2,4,6-triaminoquinazoline Antimalarial activity Antineoplastic activity Antibacterial activity Aminoquinazolines

收稿日期 1993-03-30 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

扩展功能

本文信息

- Supporting info
- PDF (325KB)
- [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

- 氨基喹唑啉
- 5-氟-2
- 6-三氨基喹唑啉
- 抗疟活性
- 抗肿瘤活性
- 抗菌活性

本文作者相关文章

- 蒙小英
- 刘进前
- 张秀平
- 陈秀华
- 余爱珍
- 戴祖瑞

PubMed

- Article by
- Article by
- Article by
- Article by
- Article by
- Article by

1. 周伟澄; 忻志铭; 李炳生; 李高德; 张秀平. 碘化1-甲基-2,4-二氨基-6-(N-甲基-取代苄氨基)喹唑啉鎓的合成及其抗疟和抗肿瘤作用[J]. 药学学报, 1989,24(12): 953-956
2. 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]. 药学学报, 1991,26(5): 383-386
3. 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疟、抗肿瘤和抗菌活性[J]. 药学学报, 1991,26(11): 821-828
4. 蒙小英; 张秀平; 李炳生; 李高德. 2,4-二氨基-5-甲基-6-取代苄氨基喹唑啉生物体的合成及其抗疟和抗肿瘤作用[J]. 药学学报, 1989,24(8): 578-586
5. 周伟澄; 李广云; 忻志铭; 李炳生; 陈根娣; 戴祖瑞; 张秀平. 2,4-二氨基-6-(N-甲基-取代苄氨基)喹唑啉类化合物的合成和抗疟以及抗肿瘤活性[J]. 药学学报, 1989,24(2): 99-104
6. 李广云; 张秀平; 忻志铭; 戴祖瑞; 陈林; 龚建章. 疟疾防治药物的研究——XI. 2,4-二氨基-6-(N-取代-对氯苄氨基)喹唑啉生物体的合成及其抗疟作用[J]. 药学学报, 1984,19(2): 108-118
7. 张秀平; 陈根娣; 戴祖瑞; 马志明. 疟疾防治药物的研究——XII. 2,4-二取代-6-取代氨基喹唑啉生物体的合成及其抗疟作用[J]. 药学学报, 1984,19(10): 792-795
8. 张洪北; 邓蓉仙; 丁德本; 时云林; 杨俊德; 郭宝忠. 抗疟药的研究——XVI. 2,4-二氨基-6-[(取代苯基)硫代、亚硫酸、硫酰]喹唑啉类化合物的合成及抗疟作用[J]. 药学学报, 1984,19(11): 860-864
9. 李广云; 张秀平; 戴祖瑞; 陈林. 疟疾防治药物的研究——VII. 2,4-二哌啶(或吡咯啉)基-6-取代氨基喹唑啉生物体的合成及其抗疟作用[J]. 药学学报, 1982,17(11): 827-834

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: 40%;" type="text"/> 5223