

论文

氨甲喋呤- α -肽的固相合成

施溥涛;郝晓柯;陈颖;张盈华;陶秦渝

中国科学院上海生化研究所,上海100031; **第四军医大学唐都医院中心实验室,西安710038

摘要:

用固相肽合成法合成了氨甲喋呤(MTX)与MTX- α -苯丙氨酸及精氨酸衍生物,产物不经进一步分离纯化即可达到HPLC单峰,质谱分析其分子量符合理论值。MTX- α -苯丙氨酸经羧肽酶-A处理后,可完全降解为MTX。体外细胞毒性试验,两者活性差异在100倍以上,提示MTX- α -苯丙氨酸是一理想的前体药物。

关键词: 固相合成 MTX MTX- α -苯丙氨酸 羧肽酶 细胞毒性

THE SOLID-PHASE SYNTHESIS OF METHOTREXATE- α -PEPTIDES

PT Shi;XK Hao;Y Chen;YH Zhang and QY Tao

Abstract:

Methotrexate(MTX) and the methotrexate- α -peptides(MTX- α -phenylalanine and MTX- α -arginine ie. MTX - α -Phe and MTX- α -Arg) were prepared with the technique of solid-phase peptide synthesis. Its purity was verified as a single peak by HPLC and its molecular weight was measured by mass spectrometry. MTX- α -Phe could be hydrolyzed to MTX by carboxypeptidase A. The cytotoxic effect of released MTX was found to be 100 times stronger than that of the peptide *in vitro*. It is suggested that MTX- α -Phe is a satisfactory prodrug in the treatment of cancer.

Keywords: Methotrexate Phenylalanine Carboxypeptidase Cytotoxic Prodrug Solid-phase synthesis

收稿日期 1996-01-16 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. 杨天明;刘刚. 吡啶及其类似物的药理活性和固相合成研究进展[J]. 药学报, 2006,41(8): 694-701
2. 褚季瑜;丁捷飞;刘寅曾;朱宝亭;褚云鸿.LHRH类似物的设计和合成[J]. 药学报, 1989,24(2): 95-98
3. 杨国玲;李仁德;王珠银;胡晓愚.P-物质活性片段同类物(SP-6)的合成与生理活性研究[J]. 药学报, 1994,29

扩展功能

本文信息

- ▶ Supporting info
- ▶ PDF(331KB)
- ▶ [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

- ▶ 固相合成
- ▶ MTX
- ▶ MTX- α -苯丙氨酸
- ▶ 羧肽酶
- ▶ 细胞毒性

本文作者相关文章

- ▶ 施溥涛
- ▶ 郝晓柯
- ▶ 陈颖
- ▶ 张盈华
- ▶ 陶秦渝

PubMed

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

(7): 553-557

4. 高峰;施薄涛;臧益民;牛国保.大鼠心房肽III及其小分子类似物的合成与生物活性[J]. 药学学报, 1994,29(6): 417-426

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="2890"/> |

Copyright 2008 by 药学学报