

论文

7-酰氨基-3-(1,2,3-三唑甲基)头孢菌素衍生物的合成及其抗菌活性

张存瑜;胡树琛;周慧殊;段廷汉

中国药科大学半合成抗生素研究室,南京210009

摘要:

本文以青霉素G扩环而得的7-苯乙酰氨基-3-甲基-3-头孢烯-4-羧酸(I)为原料,合成了12个C<sub>3</sub>位上有1,2,3-三唑甲基取代的新头孢菌素衍生物(VIII<sub>1~12</sub>),并经分析确证了各化合物的结构。体外抑菌试验结果表明,其中6个化合物,即VII<sub>2~4,9~11</sub>,不仅对革兰氏阳性菌有较高的抑制作用。而且对革兰氏阴性菌也有高度敏感性。

关键词: 口服头孢菌素 7-酰氨基-3-(1,2,3-三唑甲基)头孢菌素 抗菌活性 构效关系

SYNTHESIS AND ANTIMICROBIAL ACTIVITY OF 7-ACYLAMIDO-3-(1,2,3-TRIAZOL-1-YLMETHYL) CEPHALOSPORINS

CY Zhang; SC Hu; HS Zhou and TH Duan

Abstract:

In order to develop oral cephalosporin exhibiting broad-spectrum activity, a series of cephalosporin derivatives (VIII<sub>1~12</sub>) bearing 1,2,3-triazolylmethyl substituents on the C<sub>3</sub> position were synthesized. 7-Phenylacetamido-3-methyl-3-cephem-4-carboxylic acid (I) was employed as starting material and converted to VIII by procedures of esterification and oxidation, bromination, azido-substitution, dipolar cycloaddition, deprotection, cleavage, and condensation. Minimum inhibitory concentration (MIC) values *in vitro* showed that VIII<sub>2~4,9~11</sub> had a wide antibacterial spectrum against Gram positive and Gram negative bacteria and possessed high activities. Further biological evaluation and the study of oral absorption for the six compounds will be performed.

Keywords: 7-Acylamido-3-(1,2,3-triazol-ylmethyl) cephalosporins Antibacterial activity Structure-activity relationship Oral cephalosporin

收稿日期 1989-12-20 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

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.)

扩展功能

本文信息

- Supporting info
- PDF(382KB)
- [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

- 口服头孢菌素
- 7-酰氨基-3-(1,2,3-三唑甲基)头孢菌素
- 抗菌活性
- 构效关系

本文作者相关文章

- 张存瑜
- 胡树琛
- 周慧殊
- 段廷汉

PubMed

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

反馈人

邮箱地址

反  
馈  
标  
题

验证码

4953