

论文

抗疟药的研究——XVI. 2,4-二氨基-6-[(取代苯基)硫代、亚硫酰、硫酰]喹唑啉类化合物的合成及抗疟作用

张洪北;邓蓉仙;丁德本;时云林;杨俊德;郭宝忠

军事医学科学院微生物流行病学研究所,北京

摘要:

关键词: 抗疟药 氨基喹唑啉 病因性预防作用

STUDIES ON ANTIMALARIAL AGENTS XVI. SYNTHESSES AND ANTIMALARIAL ACTIVITIES OF 2, 4-DIAMINO-6-[(SUBSTITUTED PHENYL)THIO, SULFINYL AND SULFONYL] QUINAZOLINES

ZHANG Hong-Bei; DENG Rong-Xian; DING De-Ben; SHI Yun-Lin; YANG Jun-De and GUO Bao-Zhong

Abstract:

2,4-Diamino-6-[(substitutedphenyl) thio]quinazolines (VIIa~d) were prepared via condensation of 2-nitro-5-chlorobenzonitrile with substituted thiophenols, followed by reduction with stannous chloride and cyclization with chloroformamide hydrochloride or cyano guanidine. Oxidation of VIIa~c with hydrogen peroxide afforded corresponding sulfinyl and sulfonyl derivatives(VIIIa~c and IXa~c) , The compounds were screened for suppressive antimalarial activity against P. berghei in mice and for causal prophylactic action against P. yoelii in mice. With the exception of VIIa,d and VIIa, all compounds exhibited marked antimalarial activity against blood induced plasmodium berghei in mice. Compounds VIIc, VIIIb,c and IXc suppressed parasitemia at 1.25 mg/kg. Compounds VIIIb,c and IXb,c were shown to have causal prophylactic activity against P. yoelii at 1.25 mg/kg and 0.625 mg/kg. Among them VIIIc was the most potent. It suppressed parasitemia at 0.3125 mg/kg and was shown to have prophylactic activity at 0.078 mg/kg.

Keywords: Aminoquinazolines Causal prophylactic activity Antimalarials

收稿日期 1983-08-19 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

- 冯正;吴祖帆;王翠英;江善根.<sup>3</sup>H-咯萘啶在小鼠体内的分布和排泄[J]. 药学报, 1988,23(8): 629-632
- 李成韶;杜以兰. 效量半衰期t<sub>1/2</sub>(ED)及其计算公式[J]. 药学报, 1986,21(3): 165-169
- 冯正;江乃雄;王翠英;张炜. 抗疟药咯萘啶在兔体内的药代动力学[J]. 药学报, 1986,21(11): 801-805
- 陈一心;虞佩琳;李英;嵇汝运. 青蒿素类似物的研究 III. 二氢青蒿素二元酸双酯和单酯类衍生物的合成[J]. 药学报, 1985,20(2): 105-111
- 虞佩琳;陈一心;李英;嵇汝运. 青蒿素类似物的研究 IV. 含卤素、氮、硫等杂原子的青蒿素衍生物的合成[J]. 药学报, 1985,20(5): 357-365
- 陈一心;虞佩琳;李英;嵇汝运. 青蒿素类似物的研究 VII. 双(二氢青蒿素)醚和双(二氢脱氧青蒿素)醚类化合物的合成[J]. 药学报, 1985,20(6): 470-473
- 张景丽;李金翠;吴毓林. 臭氧化合成青蒿素类似物[J]. 药学报, 1988,23(6): 452-455
- 李成韶;杜以兰;张翠莲;赵新静. 双氢青蒿素对小鼠抗疟作用的药效动力学[J]. 药学报, 1989,24(7): 487-489
- 汪南华;王锐;冷宗康;彭司勋. 2-甲酰(乙酰)取代喹啉缩氨基硫脲的合成[J]. 药学报, 1990,25(12): 920-925
- 李铜铃;庞其捷;贺于玲;王平. 肝靶向抗疟药半乳糖基拟糖白蛋白-伯氨喹偶联物和磷酸伯氨喹的药代动力学[J]. 药学报, 1995,30(10): 721-725
- 钟景星;邓蓉仙;王俭;郑启泰;焦克芳. 抗疟药α-(二正丁氨基甲基)-2,7-二氯-9-对氯苄基-4-萘甲醇的晶体和分子结构[J]. 药学报, 1997,32(11): 824-829
- 周伟澄;忻志铭;张秀平;沈杰;丘巧平. 一种新的三嗪类抗锥虫药:SIPI-1029及其类似物的合成和抗原虫作用[J]. 药学报, 1996,31(11): 823-830
- 仲伯华;邓蓉仙;时云林;李国富;钟景星;杨俊德;王俭. 4-甲基-5-取代苯氧基-伯氨喹类似物的合成及抗疟活性的初步评价[J]. 药学报, 1994,29(4): 268-275
- 叶斌;吴毓林;李国富;焦岫卿. 脱氧青蒿素的抗疟活性[J]. 药学报, 1991,26(3): 228-230
- 仲伯华;邓蓉仙;钟景星;王俭. 2-甲基-5-取代苯氧基伯氨喹的合成及其抗疟活性[J]. 药学报, 1990,25(3): 167-172
- 宣文漪;赵一;李爱媛;谢沛珊;刘旭. 青蒿琥酯经皮肤吸收治疗疟疾的疗效[J]. 药学报, 1990,25(3): 220-222
- 蒙小英;张秀平;李炳生;李高德. 2,4-二氨基-5-甲基-6-取代苯氨基喹唑啉衍生物的合成及其抗疟和抗肿瘤作用[J]. 药学报, 1989,24(8): 578-586
- 杨忠顺;李英. 与青蒿素相关的1,2,4-三恶烷及臭氧化物的研究进展[J]. 药学报, 2005,40(12): 1057-1063
- 姚文莉;沈季华;张明立;王云玲;张洪北;王全典;李福林. 抗疟药的研究 VII. α-(烷氧基)-2-苯基-4-喹唑啉甲醇类化合物的合成[J]. 药学报, 1984,19(1): 76-78
- 周义清;李国富;钟景星;董正福;高徐生. 2,4-二氨基-6-取代氨基磺酰喹唑啉类化合物抗疟作用的研究[J]. 药学报, 1984,19(4): 245-250
- 赵德昌;张志祥;时云林;丁德本;王淑芬;杨俊德;郭保忠;邓蓉仙. 抗疟药的研究——IX. 5-取代苯氧基-6-甲氧基-8-[(1-乙基-4-氨基丁基)氨基]喹唑啉类化合物的合成[J]. 药学报, 1984,19(4): 303-305
- 邓蓉仙;钟景星;董正福;王俭;丁德本;时云林;王淑芬;杨俊德;郭保忠;高徐生. 抗疟药的研究 XI. 4-甲基-5-取代苯氧基伯氨喹的合成及其抗疟作用[J]. 药学报, 1984,19(5): 343-348
- 李成韶;杜以兰. 根据青蒿素药效半衰期制订给药方案的探讨[J]. 药学报, 1984,19(6): 410-414
- 陈林;郭凤川;戴祖瑞;李从军. 伯氏疟原虫ANKA株模型的建立及其在抗疟药筛选中的应用[J]. 药学报, 1984,19(10): 732-736
- 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-取代氨基喹唑啉衍生物的合成及其抗疟作用[J]. 药学报, 1984,19(10): 792-795
- 陈根娣;张秀平. 疟疾防治药物的研究——XIII. 3-取代氨基喹唑啉-4衍生物的合成[J]. 药学报, 1984,19(10): 796-798
- 许德余;陈雄;殷祥生;宁晓闽. 合成抗疟药研究 VI. 三嗪喹唑啉类化合物的合成及其抗疟活性[J]. 药学报, 1983,18(1): 20-24

- ▶ Supp
- ▶ PDF
- ▶ [HTM
- ▶ 参考
- ▶ 把本
- ▶ 加入
- ▶ 加入
- ▶ 引用
- ▶ Ema
- ▶ 文章
- ▶ 浏览
- ▶ 抗疟
- ▶ 氨基
- ▶ 病因
- ▶ 张洪
- ▶ 邓蓉
- ▶ 丁德
- ▶ 时云
- ▶ 杨俊
- ▶ 郭宝
- ▶ Artic
- ▶ Artic
- ▶ Artic
- ▶ Artic
- ▶ Artic
- ▶ Artic

28. 钟景星;张明立;王云玲;董正福;邓蓉仙. 抗疟药的研究IV——2,4-二氨基-6-取代氨基磺酰唑啉的合成[J]. 药化学报, 1983,18(3): 231-233
29. 张志祥;张松;丁德本;邓蓉仙. 抗疟药的研究——III. 2-(取代苯乙烯基)-4-氨基吡啶类的合成[J]. 药化学报, 1983,18(4): 261-265
30. 戴祖瑞;陈林;李裕棠;龚建章. 食蟹猴疟原虫——斯氏按蚊系统猴疟模型的一些生物学特性和对常用抗疟药物的生物效应[J]. 药化学报, 1983,18(12): 881-886
31. 陈昌;高芳华;王灵. 抗疟新药的研究: 笨腈[g]唑啉氨基酚双Mannich碱类化合物的合成[J]. 药化学报, 1983,18(12): 965-968
32. 赵德昌;钟景星;耿荣良;李国福;丁德本;邓蓉仙. 抗疟药的研究——II.  $\alpha$ -烷氨基甲基-1,6-二氯-4-萘甲醇类化合物的合成[J]. 药化学报, 1982,17(1): 28-32
33. 管惟滨;黄文锦;周元昌;龚建章. 体外微量测定抗疟药药效的方法[J]. 药化学报, 1982,17(2): 139-142
34. 邵葆若;叶秀玉;郑浩. 伯氏鼠疟原虫(*Plasmodium berghei*)对咯萘啶抗药性的研究[J]. 药化学报, 1982,17(8): 566-571
35. 李广云;张秀平;戴祖瑞;陈林. 疟疾防治药物的研究——VII. 2,4-二嘧啶(或吡咯啶)基-6-取代氨基唑啉衍生物的合成及其抗疟作用[J]. 药化学报, 1982,17(11): 827-834
36. 朱定球;戴祖瑞;李进才;蒋增康. 长效抗疟药—啶吩防治鼠疟的实验研究[J]. 药化学报, 1982,17(12): 894-898

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="6702"/>
<input type="text"/>			

Copyright 2008 by 药化学报