



中国精品科技期刊 | 中国高校精品科技期刊 | 中国中文核心期刊

中国药科大学学报

JOURNAL OF CHINA PHARMACEUTICAL UNIVERSITY

站内搜索

中文标题 从 到

最新录用

[更多>>](#)

- 稳定沉默TRB3细胞模型及TRB3启动子报告基因的建立
- 柴胡醋制前后柴胡皂苷a、b2、c、d的LC-MS/MS法测定及比较
- 喷雾干燥氯诺昔康自微乳化制剂的制备及理化性质研究

二氟代苯甲亚砷基乙酰胺类化合物的合成与生物活性

[点此下载全文](#)

引用本文: 朱雄,黄文龙,皋聪,朱炎,张印广,凌勇.二氟代苯甲亚砷基乙酰胺类化合物的合成与生物活性[J].中国药科大学学报(中文版),2012,43(1):16-20

摘要点击次数: 177

全文下载次数: 126

作者	单位
朱雄	中国药科大学医药化工研究所
黄文龙	中国药科大学新药研究中心
皋聪	中国药科大学药理学教研室
朱炎	中国药科大学医药化工研究所
张印广	北京协和药厂
凌勇	南通大学医学院

中文摘要:在莫达非尼的结构基础上设计并合成了一系列新的二氟代苯甲亚砷基乙酰胺类化合物,并对这些化合物的中枢兴奋活性进行了测定。以二(4-氟苯基)甲醇为原料,经取代、酯化、胺解和氧化等反应合成了二氟代苯甲亚砷基乙酰胺类衍生物,共计16个目标化合物(5a~5p),其结构经ESI-MS、¹H NMR、IR和元素分析确证,然后以小鼠自主活动实验测定了其中枢兴奋活性。初步研究表明,化合物5a, 5b, 5c, 5e以及5j能提高小鼠的自主活动,其中化合物5b的中枢兴奋活性与莫达非尼相当。

中文关键词:[莫达非尼](#) [亚砷基乙酰胺](#) [合成](#) [中枢兴奋活性](#)

Synthesis and biological evaluation of novel difluorophenyl methanesulfinyl acetamide derivatives

Abstract:Based on the study results of known structure-activity relationships(SARs) of modafinil derivatives,a series of difluorophenyl methanesulfinyl acetamide compounds were designed and synthesized,and their central stimulative activities were investigated.The target compounds were synthesized starting from di(4-fluorophenyl) methanol by substitution,esterification,amination and oxidation. Sixteen target compounds(5a~5p) were synthesized and their structures were confirmed by ESI-MS,¹H NMR,IR and elemental analysis. Their central stimulative effects were evaluated by the independent activity assay in mice. Preliminary results of pharmacological test showed that compounds 5a,5b,5c,5e and 5j enhanced activities of healthy mice,and the central stimulative activity of 5b was comparable to that of the positive control modafinil.

keywords:[modafinil](#) [sulfinyl acetamide](#) [synthesis](#) [central stimulative activity](#)

[查看全文](#) [查看/发表评论](#) [下载PDF阅读器](#)

版权所有:《中国药科大学学报》编辑部 苏ICP备11026256号

地址:江苏省南京市童家巷24号(210009) 电话:025-83271566,83271562 传真:025-83271279 E-mail:cpuxuebao@sohu.com;cpuxuebao@yahoo.com.cn

技术支持:北京勤云科技发展有限公司

