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



# 白杨素衍生物的合成及其抗肿瘤活性

点此下载全文

**引用本文：** 任杰,程虹,王炜,胡昆.白杨素衍生物的合成及其抗肿瘤活性[J].中国药科大学学报(中文版),2011,42(3):206-212

**摘要点击次数: 445**

**全文下载次数: 348**

| 作者 | 单位 |
| --- | --- |
| 任杰 | 常州大学制药与生命科学学院 |
| 程虹 | 常州大学制药与生命科学学院 |
| 王炜 | 常州大学制药与生命科学学院 |
| 胡昆 | 常州大学制药与生命科学学院 |

**基金项目:**江苏省企业博士集聚计划资助项目

**中文摘要:**利用Baker-Venkataraman重排法，以2,4,6-三羟基苯乙酮为原料，经羟基保护、酰化、重排、成环、脱保护5步反应全合成白杨素。以白杨素为骨架，再利用7位羟基的活性，在C-7位引入水溶性基团——烷胺基，设计合成了未见文献报道的21种白杨素系列衍生物**8a-8u**，其结构经$^{1}$H NMR、$^{13}$C NMR、IR和MS确证。采用MTT法评价了目标化合物对HCT-116(人体结肠癌细胞系)，HeLa（人体宫颈癌细胞系），DU-145（人体前列腺癌细胞系），SGC-7901(人体胃癌细胞系)和HEK-293(人胚肾细胞系)的抗肿瘤活性。其体外抗肿瘤活性实验表明，7-(2-哌嗪乙氧基)-5-羟基-2-苯基-4*H*-1-苯并吡喃-4-酮(**8o**)具有较好的抗肿瘤活性。

**中文关键词:**白杨素 衍生物 合成 抗肿瘤活性 MTT检测

## Synthesis and antitumor activity of novel chrysin derivatives

**Abstract:**Chrysin was synthesized in five steps starting from 2,4,6–trihydroxyacetophenone via methylation, acylation, Baker-Venkataraman rearrangement, cyclization and deprotection.With chrysin as the lead compound,novel chrysin derivatives **8a-8u** were designed and synthesized.The chemical structures of these compounds were confirmed by $^{1}$H NMR, $^{13}$C NMR,IR and MS.Twenty-one new chrysin derivatives were prepared and their antitumor activities were evaluated by MTT method on HCT-116 (human colon cancer cell line),HeLa (human cervical carcinoma cell line), DU-145 (human prostate cell line), SGC-7901 (human gastric cancer cell line),and HEK-293 (human embryonic kidney cell line).Among these derivatives, 5-hydroxy-2-phenyl-7-(2-(piperazin-1-yl) ethoxy)-4*H*-chromen-4-one (**8o**) had the most potent antitumor activity against HCT-116, HeLa, DU-145, and SGC-7901 cells.

**keywords:**Chrysin derivatives synthesis antitumor activities MTT assay

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