

- 1997, **21**(4): 200
- 4 陈维洲主编. 心血管药理学进展(1994-1995 年). 北京: 人民卫生出版社, 1995. 6
- 5 Grehn L, Gunnarsson K, Raynarrsson U. Selective cleavage of Boc-amides. A novel approach to deacylation of carboxamides. *Acta Chem Scand Ser B*, 1987, **B41**(1): 18
- 6 Mills K, Eldred CD, Oxford AW. Preparation of 5-[2-(acylamino) ethyl] tryptamines as antimigraine agents. *Ger Offen*, DE3, 700, 408
- 7 Alimardanov RS, Eminer GO, Teziy R *et al*. Synthesis of alkylal koxyhalobenzenes. *Molodykh Vch. -Khim. Azerb*, 1974, 96

## Synthesis and Antiarrhythmic Activity of Some Methylsulfonamido-phenylethylamino Derivatives

Liu Hong, Ji Min, Liu Ligang, Jing Song, Hua Weiyi, Liu Ruimei

New Drug Research Center, China Pharmaceutical University, Nanjing 210009

**Abstract** Selecting class III antiarrhythmic compound dofetilide as lead compound, started from phenylethylamine, six novel N-substituted methylsulfonamido phenylethylamino derivatives were designed and synthesized through seven step chemical reactions. Their chemical structures were determined by IR,  $^1\text{H}$ NMR and MS. The pharmacological study showed that these new compounds exhibit antiarrhythmic activities to varying degree in rats arrhythmia induced by aconitine. The antiarrhythmic activity of three compounds (**6a**, **6b**, **6c**) with an effective dose of 5 mg/kg was similar to that of dofetilide.

**Key words** Methylsulfonamido-phenylethylamino; Class III antiarrhythmic agents; Synthesis

**【文摘 005】** 三环氟喹诺酮类化合物的合成及其抗菌活性研究 熊文南, 王尔华, 唐志悦. 中国药物化学杂志, 1998, **8**(3): 174

在保留芦氟沙星(rufloxacin)母核基本骨架的基础上进行结构修饰, 以 7, 8-二氟-3, 4-二氢-1, 4-苯并噁嗪为起始原料, 经缩合环合、螯合、亲核取代、水解反应, 合成了 7 个化合物, 并测试了其体外抑菌活性, 其中化合物(IV<sub>1</sub>)的体外抑菌活性优于芦氟沙星。

**【文摘 006】** 重组丝氨酸羟甲基转移酶活性测定及酶促反应条件的优化研究 陈志宏, 吴梧桐, 项冰, 高鹏. 药物生物技术, 1998, **5**(2): 75

采用高效液相色谱法测定重组丝氨酸羟甲基转移酶活力, 并利用该法将一系列的反应条件(温度、pH、辅因子浓度等)加以优化, 从而确定了该酶促反应的最佳反应条件。在该反应条件下, 对底物甘氨酸的转化率可达 78%。

**【文摘 007】** 脂肪酸的分析方法研究 徐秀兰, 胡磊军, 吴梧

桐. 药物生物技术, 1998, **5**(3): 161

用毛细管气相色谱法对十四碳到二十二碳的脂肪酸甲酯进行了分析, 用气质联用法考察了用等效链长度(ECL)值对未知脂肪酸进行定性的可能性, 及银化薄层色谱法(Ag-TLC)分离脂肪酸的特点。结果表明, 用等效链长度值可以对大多数未知脂肪酸进行定性。并提出结合银化薄层色谱法和用毛细管气相色谱法对生物样品中复杂脂肪酸成分进行分析的方法。

**【文摘 008】** 吸附法分离生物转化反应液中 L-苯丙氨酸 李泰明, 孙士霖, 吴梧桐, 王 . 药物生物技术, 1998, **5**(3): 145

为了分离提取生物转化反应液中 L-苯丙氨酸(L-Phe), 选用了几种吸附材料。结果显示: 用南开牌 NKA-II 吸附树脂效果最好, 吸附率平均 86.42%, 且易于被 95%乙醇动态洗脱, 洗脱率在 90%左右, 纯度 87.23%。结合离子交换等方法可以较为简便地纯化反应液中 L-Phe。