

论文

强效镇痛剂研究 III.3,5-桥丙烷基哌啶类衍生物的合成

朱友成;方苏南

中国科学院上海药物研究所

摘要:

本文根据3,5-桥丙烷哌啶类(I)及芬太尼类镇痛剂化学结构与药理作用的特点,合成了3-甲基-3,5-桥丙烷基哌啶类衍生物(IV)及一类新的合并两者结构后的合成镇痛剂N-[1-(β-芳乙基)-3-甲基(或氢)-3,5-桥丙烷基哌啶基]-N-丙酰芳胺(III)。药理初筛表明,所有这些化合物的镇痛强度大多与吗啡同一水平。

关键词: 芬太尼 镇痛 吗啡 3,5-桥丙烷基哌啶 3-甲基芬太尼

STUDIES ON POTENT ANALGESICS III. SYNTHESIS OF 3,5-PROPANOPIPERIDINE DERIVATIVES

ZHU You-cheng and FANG Su-nan

Abstract:

According to relationship of chemical structure and analgesic activity between 3,5-propanopiperidine analgesics (I) and fentanyl, we prepared 1-(β-phenylethyl)-3-methyl-4-methoxy-4-(m-hydroxyphenyl)-3,5-propanopiperidine (IV) and a new series of analgesics e. g. N-[1-(β-arylethyl)-3-methyl (or hydrogen)-3,5-propanopiperidyl]-N-arylpropanamide(III) which combined the structures of the two compounds. Pharmacological results showed that most of these compounds are of the same level of potency as morphine.

Keywords: Analgesic Morphine 3,5-Propanopiperidine 3-Methylfentanyl Fentanyl

收稿日期 1980-12-17 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

1. 胡建国;李玉林;陈冀胜.4-取代芬太尼类化合物的晶体结构和构效关系[J]. 药学报, 1987,22(11): 864-868
2. 朱友成;吴吉安;徐修容.3-甲基芬太尼衍生物QSAR研究[J]. 药学报, 1985,20(4): 267-276
3. 丁平羽;李润涛;蔡孟深.双芬太尼类化合物的合成及镇痛活性研究[J]. 药学报, 1998,33(10): 737-740
4. 翁坚慧;徐修容;朱友成;周杰;徐珩;池志强.3-甲基芬太尼衍生物构效关系及受体结合特征研究[J]. 药学报, 1990,25(3): 178-185
5. 杨玉龙;卢志英;朱国政;杨志杰;李云祥;赵淑媛;陈春华;张开镐.4-甲氧羰基-4-N-丙酰苯胺基哌啶1位衍生物的合成及其镇痛作用[J]. 药学报, 1990,25(4): 253-259
6. 杨玉龙;卢志英;杨志杰;赵淑媛;张金宝;肖鲁沂.4-甲氧羰基芬太尼类似物的合成及其镇痛作用[J]. 药学报, 1991,26(7): 493-498
7. 陈晓盼;杨玉龙;陈常英;商尔.顺-3-甲基芬太尼的4-N-丙酰基结构类似物的合成与镇痛活性及构效关系的研究[J]. 药学报, 1992,27(7): 503-509
8. 易毛;朱国政;李建国;陈冀胜.4-甲氧羰基芬太尼1-位衍生物的合成及生物活性[J]. 药学报, 1992,27(10): 734-737
9. 戎锁宝;蒋华良;池志强;陈凯先;朱友成;嵇汝运.3-甲基芬太尼衍生物立体异构体的 QSAR 研究[J]. 药学报, 1997,32(6): 420-425
10. 金昔陆;金文桥;周德和;李桂芬;池志强.麻醉剂量羟甲芬太尼对大鼠血浆皮质酮、皮质醇和抗利尿激素含量的影响[J]. 药学报, 1997,32(3): 228-230
11. 王智贤;朱友成;蒋凝;嵇汝运.HPLC和<sup>1</sup>HNMR分析确定cis-A-和cis-B-羟甲芬太尼的组成和构型[J]. 药学报, 1995,30(7): 500-505
12. 朱友成1;2:C.Prenant;2:C.Crouzel;2:池志强1.新的高强度高选择性阿片μ受体激动剂[<sup>14</sup>C]-羟甲芬太尼的合成[J]. 药学报, 1994,29(11): 823-828
13. 王智贤;朱友成;嵇汝运;吕扬;田之悦;郑启泰.羟甲芬太尼立体异构体的晶体结构[J]. 药学报, 1994,29(6): 433-437
14. 王智贤;朱友成;陈新建;嵇汝运.3-甲基芬太尼立体异构体的合成、绝对构型和镇痛活性[J]. 药学报, 1993,28(12): 905-910
15. 温素姐;杨玉龙;邵华宙;张开镐;李玉林;陈冀胜.4-甲氧羰基芬太尼非芳基类似物的合成及镇痛作用[J]. 药学报, 1993,28(3): 181-187
16. 李密;郑继旺;刘彦红;张继兰;刘令尼;蔡志基.哌芬太尼的主要药效和致依赖性潜力的实验研究[J]. 药学报, 1991,26(4): 241-245
17. 朱国政;李云祥;颜松民.3-甲基芬太尼衍生物的合成及镇痛活性[J]. 药学报, 1990,25(11): 811-814
18. 卢志英;赵淑媛;袁小妹;杨玉龙.4-甲氧羰基芬太尼的4-N-丙酰基结构类似物的合成与镇痛活性[J]. 药学报, 1990,25(5): 336-339
19. 朱友成;吴瑞琴;仇达萍;黄忠明;张鸿萍;池志强.强效镇痛剂研究——VI.顺-3-甲基芬太尼的4-N-丙酰基的结构改变与镇痛活性[J]. 药学报, 1983,18(8): 591-596
20. 方苏南;葛邦(钗仑);戴淇源;李庆祯;周德和;倪崇虎;吴瑞琴;黄忠明.强效镇痛剂研究——V.N-[1-(β-羟基-β-苯乙基)-3-甲基-4-哌啶基]-N-丙酰苯胺(7302)酯类衍生物的合成及镇痛活性[J]. 药学报, 1983,18(11): 823-828
21. 朱友成;吴瑞琴;仇达萍;黄忠明.强效镇痛剂研究 VII.1-β-羟基-3-甲基芬太尼(7302)及有关化合物非对映异构体的合成及镇痛活性[J]. 药学报, 1983,18(12): 900-904

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="5874"/>
<input type="text"/>			