

论文

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-丙酰胺(7302)酯类衍生物的合成及镇痛活性

方苏南;葛邦(方);戴淇源;李庆桢;周德和;倪崇虎;吴瑞琴;黄忠明

中国科学院上海药物研究所

摘要:

本文报道了一系列N-[1-(β -酰氧基- β -苯乙基)-3-甲基-4-哌啶基]-N-丙酰胺类衍生物及其化学结构与镇痛强度之间的关系,并测定了几个代表化合物的镇痛作用时间及与阿片受体亲和力。实验结果表明,7302的 β -羟基酯化后,均能维持一定的镇痛强度,其镇痛作用时间与母体化合物7302相近。从受体结合试验来看,酯化后与受体亲和的能力显著下降。

关键词: 芬太尼 β -酰氧基-3-甲基芬太尼 镇痛作用 镇痛作用时间 受体亲和力

STUDIES ON POTENT ANALGESICS——V. SYNTHESIS AND ANALGESIC ACTIVITY OF THE ESTER DERIVATIVES OF N-[1-(2-HYDROXY-2-PHENYLETHYL)-3-METHYL-4-PIPERIDYL]-N-PHENYLPROPANA-MIDE (7302)

FANG Su-nan; GE Bang-lun; DAI Qi-yuan; LI Qing-zhen; ZHOU De-he; NI Chong-hu; WU Rui-qin and HUANG Zhong-ming

Abstract:

In this paper, the structure and activity relationship of a series of ester derivatives of N-[1-(2-hydroxy-2-phenylethyl)-3-methyl-4-piperidyl]-N-phenylpropanamide(7302) is reported. It was found that after esterification of the β -hydroxy group of 7302, the analgesic activity could be maintained at a rather high level. The duration of analgesic action of some compounds could not be prolonged. In the binding test *in vitro*, it was found that the derivatives of esterification of 7302 decreased the affinity for receptor markedly.

Keywords: Carboxyl-3-methyl fentanyl Analgesic potency Duration of analgesic action Affinity for receptor Fentanyl

收稿日期 1981-11-18 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;陈翼胜.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;朱新文;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;陈翼胜.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¹HNMR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[¹⁴C]-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;陈翼胜.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. 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
21. 朱友成;方苏南.强效镇痛剂研究 III.3,5-桥丙烷基哌啶类衍生物的合成[J]. 药学报, 1982,17(3): 194-199

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"/> 2609
	<input type="text"/>		

Copyright 2008 by 药学报