

# 目 錄

中文摘要

英文摘要

第一章 緒論 .....	1
第一節 Furoquinolones 類化合物之研究概況 .....	1
第二節 心室細胞電氣生理及病理之概述 .....	4
第三節 血小板之生理及病理功能 .....	6
第四節 肥胖細胞與嗜中性白血球之生理功能 .....	8
第五節 小神經膠質細胞之生理功能 .....	10
第六節 巨噬細胞之生理功能 .....	10
第七節 研究動機與目的 .....	11
第二章 研究經過 .....	13
第一節 化學合成部份 .....	13
(一) Ethyl 2-(substituted anilino)-4-oxo-4,5-dihydrofuran-3-carboxylate (1-23) 類化合物之合成 .....	13
(二) Ethyl 2-(substituted anilino)-4-oxo-5-methyl-4,5-dihydrofuran-3-carboxylate (24-26) 類化合物之合成 .....	18
(三) Mono (or Di-) substituted-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin-3,4-dione (27-52) 類化合物之合成 .....	21
(四) <i>N</i> -Substituted benzyl-7-methyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (53-67) 類化合物之合成 .....	26
(五) <i>N</i> -Substituted benzyl-7-ethyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (68-82) 類化合物之合成 .....	30
(六) <i>N</i> -Substituted benzyl-7-chloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (83-97) 類化合物之合成 .....	35
(七) <i>N</i> -Substituted benzyl-7-bromo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (98-108) 類化合物之合成 .....	39
(八) <i>N</i> -Substituted benzyl-6-methyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (109-123) 類化合物之合成 .....	43
(九) <i>N</i> -Substituted benzyl-6-ethyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (124-138) 類化合物之合成 .....	47
(十) <i>N</i> -Substituted benzyl-6-chloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (139-153) 類化合物之合成 .....	52
(十一) <i>N</i> -Substituted benzyl-6-bromo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (154-163) 類化合物之合成 .....	56
(十二) <i>N</i> -Substituted benzyl-8-bromo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (164-174) 類化合物之合成 .....	60
(十三) <i>N</i> -Substituted benzyl-5,7-dichloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin-3,4-dione (175-189) 類化合物之合成 .....	64

(十四) <i>N</i> -Substituted benzyl-6,7-dichloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin-3,4-dione (190-204) 類化合物之合成 .....	68
(十五) <i>N</i> -Substituted benzyl-6,8-dichloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin-3,4-dione (205-218) 類化合物之合成 .....	73
(十六) Mono (or Di-) substituted 4-oxo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]-quinolin-3-one phenylhydrazone (219-240) 類化合物之合成 .....	78
(十七) 4-Oxo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin-3-one substituted phenylhydrazone (241-246) 類化合物之合成 .....	82
(十八) <i>N</i> -Substituted-benzyl- 6 (or 7)-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin-3,4-diones (247-251) 類化合物之合成 .....	86
<b>第二節 藥理活性試驗結果 .....</b>	<b>87</b>
壹 抗心律不整活性 .....	87
貳 血小板凝集之抑制活性 .....	102
參 肥胖細胞脫顆粒反應之抑制活性 .....	104
肆 嗜中性白血球脫顆粒反應之抑制活性 .....	111
伍 嗜中性白血球超氧自由基形成之抑制活性 .....	118
陸 一氧化氮蓄積之抑制活性 .....	130
柒 PGE <sub>2</sub> 形成之抑制活性 .....	142
捌 TNF- $\alpha$ 形成之抑制活性 .....	147
<b>第三章 結論 .....</b>	<b>158</b>
<b>第四章 實驗部份 .....</b>	<b>162</b>
<b>第一節 試藥溶媒及材料 .....</b>	<b>162</b>
<b>第二節 儀器 .....</b>	<b>165</b>
<b>第三節 化學合成方法 .....</b>	<b>166</b>
(一) Ethyl 2-(substituted anilino)-4-oxo-4,5-dihydrofuran-3-carboxylate (1-23) 類化合物之合成 .....	166
(二) Ethyl 2-(substituted anilino)-4-oxo-5-methyl-4,5-dihydrofuran-3-carboxylate (24-26) 類化合物之合成 .....	174
(三) Mono (or Di-) substituted 2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin-3,4-dione (27-52) 類化合物之合成 .....	176
(四) <i>N</i> -Substituted benzyl-7-methyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (53-67) 類化合物之合成 .....	184
(五) <i>N</i> -Substituted benzyl-7-ethyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (68-82) 類化合物之合成 .....	189
(六) <i>N</i> -Substituted benzyl-7-chloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (83-97) 類化合物之合成 .....	195
(七) <i>N</i> -Substituted benzyl-7-bromo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (98-108) 類化合物之合成 .....	200
(八) <i>N</i> -Substituted benzyl-6-methyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (109-123) 類化合物之合成 .....	204
(九) <i>N</i> -Substituted benzyl-6-ethyl-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (124-138) 類化合物之合成 .....	209

(十) <i>N</i> -Substituted benzyl-6-chloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (139-153) 類化合物之合成 .....	215
(十一) <i>N</i> -Substituted benzyl-6-bromo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (154-163) 類化合物之合成 .....	220
(十二) <i>N</i> -Substituted benzyl-8-bromo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (164-174) 類化合物之合成 .....	224
(十三) <i>N</i> -Substituted benzyl-5,7-dichloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (175-189) 類化合物之合成 .....	228
(十四) <i>N</i> -Substituted benzyl-6,7-dichloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (190-204) 類化合物之合成 .....	232
(十五) <i>N</i> -Substituted benzyl-6,8-dichloro-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin- 3,4-dione (205-218) 類化合物之合成 .....	236
(十六) Mono (or Di-)substituted 4-oxo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]-quinolin-3-one phenylhydrazone (219-240) 類化合物之合成 .....	240
(十七) 4-Oxo-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin-3-one substituted phenylhydrazone (241-246) 類化合物之合成 .....	247
(十八) <i>N</i> -Substituted benzyl-6 (or7)-2,3,4,9-tetrahydrofuro[2,3- <i>b</i> ]quinolin-3,4-diones (247-251) 類化合物之合成 .....	249
<b>第四節 藥理實驗方法與材料.....</b>	<b>251</b>
<b>參考文獻 .....</b>	<b>257</b>
<b>已發表之論文 .....</b>	<b>267</b>