

第三章 結論

著者以 2-benzyloxybenzaldehyde 為 lead compound，從事其衍生物之合成，得到 2-substituted benzyloxy benzoic acid derivatives，並將其光譜數據做充分的解析，藉此研究其抗過敏、抗發炎活性與其結構之間的關係，並企圖發掘此類化合物其他不同的藥理活性，經過抗發炎、抗過敏及抗下痢等藥理活性測試後，得到以下結果。

從抗發炎、抗過敏活性試驗結果得知，標的化合物都不具明顯活性，也暗示 lead compound 上 aldehyde 官能基是展現活性之必要基團。

從抗下痢活性試驗結果建立了初步的 SAR：

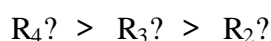
1. R_1 上的羧基取代是一個增強活性的官能基。
2. 針對化合物 **64** 而言，若將其苯環上對位取代的甲氧基改為間位取代，或置換為其他原子取代(氟原子或氯原子)，則活明顯降低，這說明此結構在苯環上有對位甲氧基取代的重要性。
3. 從 2-substituted benzylamino benzoic acid 這一類化合物(**65-73**)可看出結構中有羧基取代，若再配合上仲胺(-NH-)的結構，會形成普遍具有活性的化合物。

其次，由 $R_2?$, $R_3?$, $R_4?$ 位置上不同的取代情形可發現以下兩個規則：

(1)不同取代基所造成的抑制活性

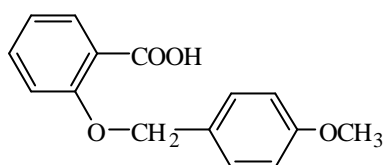


(2)不同取代位置所造成的抑制活性

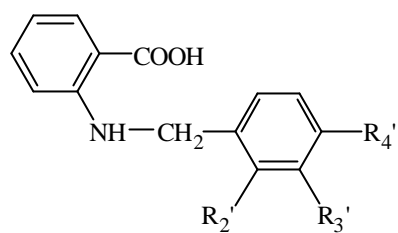


因為 2-[(4-methoxybenzyl)oxy]benzoic acid (**64**)與 2-substituted benzylamino benzoic acids **65-73** 這兩類具有明顯抗下痢活性的化合物是新穎的結構，值得繼續研討。其中化合物 **64** 及 **68** 在動物試驗(in vivo)中具有

抑制活性，值得繼續開發。



64



65 $R_2? = R_3? = R_4? = H$

66 $R_2? = Cl, R_3? = R_4? = H$

67 $R_2? = H, R_3? = Cl, R_4? = H$

68 $R_2? = R_3? = H, R_4? = Cl$

69 $R_2? = F, R_3? = R_4? = H$

70 $R_2? = H, R_3? = F, R_4? = H$

71 $R_2? = R_3? = H, R_4? = F$

72 $R_2? = H, R_3? = OCH_3, R_4? = H$

73 $R_2? = R_3? = H, R_4? = OCH_3$