中文摘要

為了得到具有強力的抗過敏、抗發炎和抗下痢活性的化合物,著者以 2-benzyloxybenzaldehyde 為先導化合物,著手進行一系列 2-substituted benzyloxy benzoic acid 及其衍生物之合成。

2-substituted benzyloxy benzonitriles **17-25**, 2-substituted benzyloxy 2-methylbenzenes **26-29**, 2-substituted benzyloxy phenyl methanols **30-33**, 2-substituted benzyloxy benzoates **34-41**, 2-substituted benzyloxy benzamides **42-44** 和 2-substituted benzylamino benzoates **45-55** 是由 substituted benzyl chloride 在無水碳酸鉀及無水碘化鉀催化下,分別和 2-氰基酚,鄰甲酚,柳酸,水楊酸甲酯,水楊醯胺,鄰氨基苯甲酸乙酯及 2-氨基-4,5-二甲氧基苯甲酸甲酯進行 benzylation 而得,另外, 2-substituted benzyloxy benzoic acids **56-64**及 2-substituted benzylamino benzoic acids **65-75** 則是應用氫氧化鈉與相關之化合物進一步進行水解反應而得。

將所合成之標的化合物進行生物活性之評估,發現 2-substituted benzyloxy benzoic acid 及其相關化合物對於抗發炎、抗過敏較不具活性。然而,2-[(4-methoxybenzyl)oxy] benzoic acid (64)和 2-[(4-chlorobenzyl)amino] benzoic acid (68)對抗下痢則具有顯著的活性表現,值得進一步探討。