• 系統編號	RC9201-0147		
• 計畫中文名稱	選擇性毒蕈素受體拮抗劑之合成研究		
• 計畫英文名稱	Synthesis of Selective Muscarinic Receptor Antagonist		
• 主管機關	行政院國家科學委員會	• 計畫編號	NSC90-2320-B038-034
• 執行機構	台北醫學院藥學系		
• 本期期間	9008 ~ 9107		
• 報告頁數	4 頁	• 使用語言	中文
• 研究人員	陳繼明 Chen, Chi-Ming		
• 中文關鍵字	毒蕈鹼受器拮抗劑；氧阿朴芬？；全合成；力利耳多摩		
• 英文關鍵字	Muscarinic antagonist；Oxoaporphine alkaloid；Total synthesis；Liriodenine		
• 中文摘要	Liriodenine 屬 7-oxoaporphine 生物鹼且有選擇對支氣管及迴腸平滑肌鬆弛作用，對毒蕈素 M3 亞型受體具有選擇拮抗作用。爲提昇受體選擇性並改善其化學性狀，本計畫係研究 Liriodenine 簡易化學合成方法。Liriodenine 以 Piperonal 爲起始物經 Pomeranz-Fritsch 反應製成 6,7-methylenedioxyisoquinoline 後，再製成 Isoquinoline reissert compound。與各種鄰位碘及溴取代之苯醛類縮合成 Benzylisoquinolines 醇類與酮類衍生物，最後經由光化學、Tributyltin hydride 及 Psychorr 等反應而分子內環化形成 Liriodenine。		
• 英文摘要	Liriodenine was found to relax tracheal and ileum of guinea pig and demonstrated a selective muscarinic M3 subtype receptor antagonist. Structural modification of liriodenine is essential for enhancement of the selectivity on receptor subtype. We like to report a new and facile synthesis of liriodenine. 6,7-methylenedioxyisoquinoline is prepared by Pomeranz-Fritsch reaction and then was converted to isoquinoline Reissert compound 2. Compound 2 was condensed with o-bromo- or o-iodobenzaldehydes to form ketones. Finally, intramolecular cyclization either by photo irradiation or tributyltin hydride or Pschorr reaction to finish the total synthesis of liriodenine.		