

Title	側鎖部にカルベン発生源を持つコレステロール同族体の合成
Sub Title	
Author	寺沢, 武志(Terasawa, Takeshi) 森崎, 益雄(Morisaki, Masuo) 池川, 信夫(Ikekawa, Nobuo)
Publisher	共立薬科大学
Publication year	1984
Jtitle	共立薬科大学研究年報 (The annual report of the Kyoritsu College of Pharmacy). No.29 (1984.) ,p.86- 87
JaLC DOI	
Abstract	
Notes	学会講演要旨
Genre	Technical Report
URL	https://koara.lib.keio.ac.jp/xoonips/modules/xoonips/detail.php?koara_id=AN00062898-00000029-0088

慶應義塾大学学術情報リポジトリ(KOARA)に掲載されているコンテンツの著作権は、それぞれの著作者、学会または出版社/発行者に帰属し、その権利は著作権法によって保護されています。引用にあたっては、著作権法を遵守してご利用ください。

The copyrights of content available on the Keio Associated Repository of Academic resources (KOARA) belong to the respective authors, academic societies, or publishers/issuers, and these rights are protected by the Japanese Copyright Act. When quoting the content, please follow the Japanese copyright act.

抑制および誘導効果について報告した。今回は ANGT 発現の調節機構を解明する目的で、ANGT 活性に対する ED および PB 投与の時期的効果について検討した。

〔実験〕 H 群雄性ラットを用い、Estradiol benzoate (2.5 mg/kg) はト殺 10 日前から 1 日おきに 1 日 1 回、皮下に連続投与し、PBNa (100 mg/kg) はト殺 4 日前から毎日 1 日 1 回、腹腔内に連続投与し、40, 50 または 60 日齢でト殺した。ANGT 活性は前回の方法に従って測定した。授乳 (親由来のホルモン等) の影響を検討するために、H および L 群のラットを使用した。

〔結果・考察〕 ED による ANGT 活性に対する抑制効果は 40 日齢ラットに観察されたが、50 および 60 日齢ラットには認められなかった。30 から 38 日齢まで ED を投与し、60 日齢でト殺したラットの ANGT 活性は抑制されていないことから、ED の抑制効果は一過性のものと考えられる。次に、母乳の影響を調べたが、生後 L (または H) 群の乳母に育てられた H (または L) 群のラットを 65 日齢でト殺して測定した ANGT 活性は、H (または L) 群に属し、ANGT 活性の H または L 型は先天的に決定されると考えられる。PB による ANGT の誘導効果は、40, 50 および 60 日齢ともに観察されたが、40 日齢における誘導効果が最も顕著であった。

ANGT 活性の一過性抑制効果は新しいタイプの GT 活性の Functional heterogeneity を示唆するものといえよう。

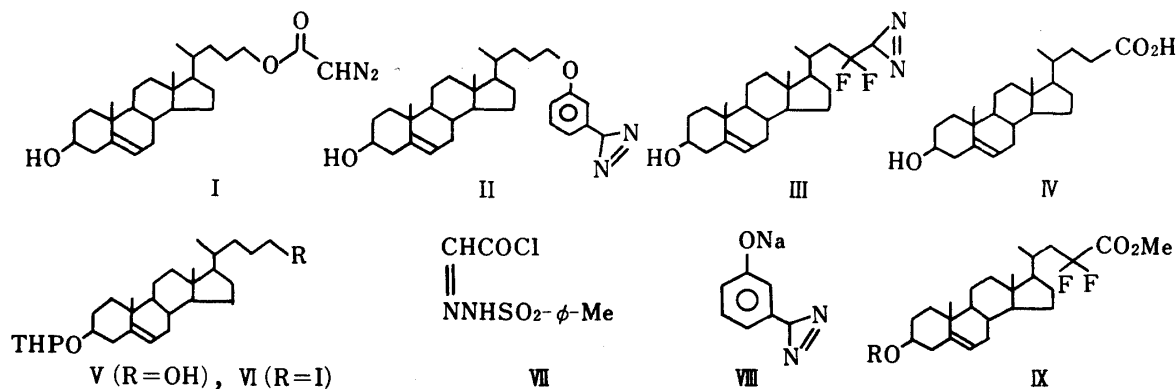
側鎖部にカルベン発生源を持つコレステロール同族体の合成

寺沢武志*, 森崎益雄, 池川信夫*

〔日本薬学会 第 104 年会 (1984年 3 月, 仙台) で発表〕

〔目的〕 コレステロールと特異的に相互作用する物質として、リン脂質、血液中のリポ蛋白、コレステロールを基質とする数種の酵素類、ジギトニン、ポリエン系抗生物質などが知られている。この相互作用に関しては従来、リン脂質とのそれについて主として物理的手段で研究されてきた。私共は光アフィニティラベル法を骨子とする化学的手段によりこの問題に取り組むべく、まず化合物 I, II, III の合成を検討した。

〔方法・結果〕 オキシカルベン、アリールカルベンおよびアルキルカルベンの発生源としてそれぞれ I, II および III を選びこれらを市販コレン酸 (IV) から合成した。グリオキシル酸のトシ



ルヒドラゾンを SOCl_2 でクロル化して得た VII を IV から誘導したアルコール V と反応後, Et_3N で処理し I-THP を得た。また V のトシレート を NaI で処理して合成したヨウ素体 VI を *m*-ヒドロキシベンズアルデヒドより数工程で合成したジアジリン VIII とカップリングさせ II-THP を得た。一方 III は IV の誘導体の α -水酸化, 酸化, Et_2NSF_3 処理で合成した IX の還元およびジアジリン化で合成できる。

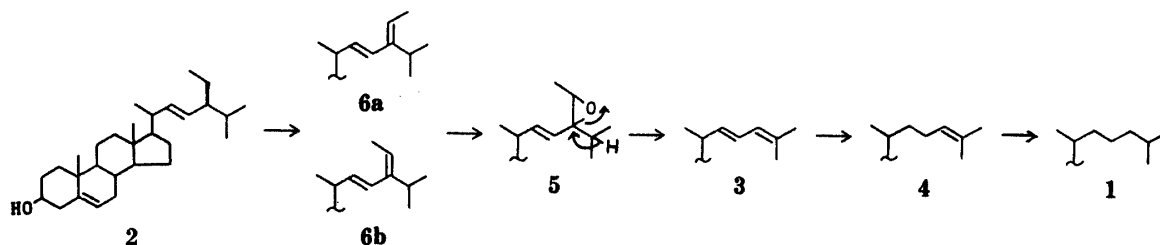
* 東京工業大学理学部

昆虫における Stigmasterol の Cholesterol への変換のメカニズム

藤本善徳*, 木村美記*, 鷹巣彰弘*, 森崎益雄, 池川信夫*

〔日本薬学会 第 104 年会 (1984年 3 月, 仙台) で発表〕

〔目的〕 昆虫における植物ステロールから cholesterol 1 への変換は, sitosterol, campesterol については 24,28-エポキシドを経由することを明らかにしてきた。しかし, stigmasterol 2 については代謝中間体として $\Delta^{22,24}$ -diene 3 および desmosterol 4 が見い出されているのみである。2 の脱エチル反応のメカニズムを下式 (25-H の 24 位への転位をともなう) と想定し, これを証明することを目的とした。



〔方法〕 重水素標識した [25-D]-2, [24-D]-2 および [23-D]-2 を化学的に合成し, 蚕に投与し生成した 1 (および 4) を GC-MS で分析した。またジエン 6a, 6b を化学的に合成し, それらの蚕体内での代謝についても調べた。

〔結果〕 GC-MS 分析の結果は蚕体内で下式の反応が進行している事を示している。即ち 23 位の水素はそのまま残り, 24 位の水素は消失している。25 位の水素は分子内 (24 位) に残っており 25-H の 24 位への転位をともなうエポキシド 5 のフラグメンテーションが起っていることを強く示唆している。また 6b 及び 6a を投与した蚕体内に 3 及び 4 を同定した。以上の結果はすべて上のメカニズムを支持している。