

Title	(2-Thiazolyl) thiourea体のニトロ化(その2)
Sub Title	
Author	与田, 玲子(Yoda, Reiko) 岡田, 智子(Okada, Tomoko) 山本, 有一(Yamamoto, Yuichi) 松島, 美一(Matsushima, Yoshikazu) 飯高, 洋一(Iitaka, Yoichi)
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.90- 91
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=AN00062898-00000029-0092

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.

れた。

X線結晶構造解析の結果、パラジウムと配位子がモル比 1:2 でチアゾール環 N とチオウレアの S と配位し、チオウレアの S がシス位のパラジウム四配位構造をとり、チアゾール環が対称であった。

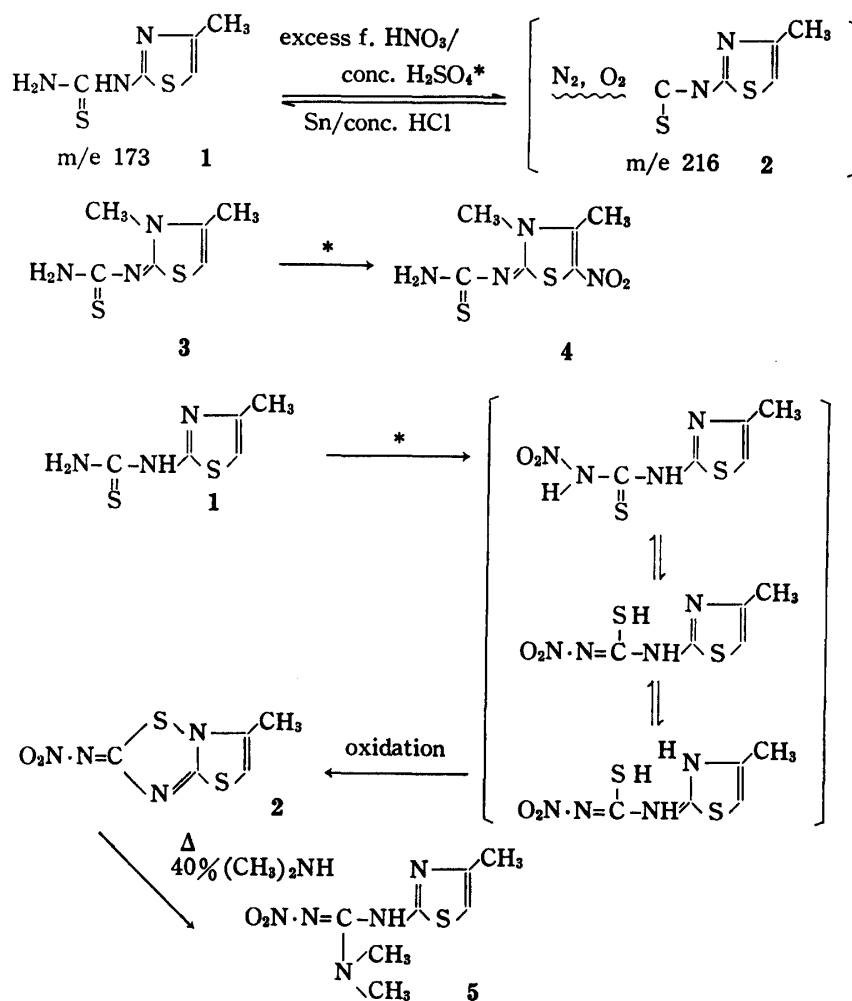
* 東京大学薬学部

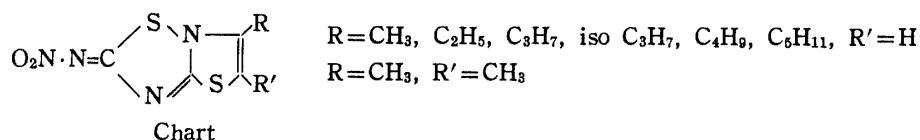
(2-Thiazolyl)thiourea 体のニトロ化 (その 2)

与田玲子, 岡田智子, (故)山本有一, 松島美一, 飯高洋一*

[日本薬学会 第 104 年会 (1984年 3 月, 仙台) で発表]

1-Monoalkyl-3-(2-thiazolyl)urea および thiourea の硫硝酸によるニトロ化によって thiazole 5 位がニトロ化され、さらに N 位にニトロ基が導入されることおよび (2-thiazolyl)thiourea の同様の条件下におけるニトロ化では対応する 5-nitrothiazolyl 化合物の他、淡黄色針状晶の新物質





2 が得られたことを先に報告した。今回、**2** の構造を決定した。

化合物 **1** のチアゾール環 4 位をメチル基からペンチル基に置換しても **2** に相当する化合物が得られた。4, 5 位のジメチル置換体でも **2** に相当する化合物が得られた。一方チアゾール環 N にメチル基が置換した化合物 **3** では 5 位ニトロ体 **4** が生成するが **2** に相当する化合物は得られなかった。このことよりチアゾール環 3 位が **2** の生成反応に関与していることがわかった。

N-モノメチル体のニトロ化でチオウレアの N 位がニトロ化していることから **1** も N 位がニトロ化され、酸化的分子内環化によりチアゾロ-チアジアゾール体が生成したと推定した。その確認のため **2** の X 線結晶解析を試みた。その結果、**2** は 6-methyl-2-nitroiminothiazolo[3,2-b]-[1,2,4]thiadiazole であることが証明された。

* 東京大学薬学部

arotinolol (S-596) の SHR における抗高血圧作用

岸浩一郎*, 川島紘一郎, 曾我部博文*

〔第19回 SHR 協議会年会 (1983年10月, 神奈川) で発表〕

〔結論〕 arotinolol (ARL) (S-596, 住友化学) の抗高血圧作用を SHR で 12 週間観察した。ARL は propranolol (PPL) に比べて、同程度の最大効力 (efficacy) と 5 倍以上の用量効力 (potency) を示した。両薬物適用による血圧低下と血漿レニン濃度 (PRC) または血漿アルドステロン濃度 (PAC) の変化の間には有意な相関はみられなかった。

〔目的〕 ARL は強い β アドレナリン遮断作用を示すと同時に¹⁾, α アドレナリン遮断作用をもつことが知られている²⁾。ARL は高血圧自然発症ラット (SHR) において、直接法により急性および亜急性 (2 週間経口適用) に降圧作用を示すことが報告されている²⁾。本実験では、SHR を用いて ARL の 12 週間経口適用による血圧作用を観察し、さらにレニン・アンジオテンシン・アルドステロン系におよぼす影響を調べた。

〔方法〕 SHR は自治医科大学薬理学教室のコロニー, F 40, オス, 10 週令を用いた。ARL および比較薬物の PPL は、0.5% methyl cellulose 水溶液に 5 ml/kg を適用するように懸濁した。薬物は経口ゾンデを用いて強制的に、12 週間毎日 1 回夕方に適用した。適用量は ARL で 20, 100 mg/kg の 2 段階, PPL は 100 mg/kg とした。対照群には溶媒を 5 ml/kg 適用した。各群 9—11 匹でスタートし、実験終了時には 4—11 匹となった。適用期間中週 1 回午後、薬物適用約 20 時間後に SHR の体重、血圧、および心拍数の測定を行なった。ラット尾動脈血圧・心拍数測定装置 (KN-210, Natsume) を用い、50°C, 3 分間の予熱の後、無麻酔下に測定した。実験終了時 (第 12 週) に腹大動脈にカニューレを挿入し、無麻酔・無拘束下に平均血圧を直接測定した。その後にカニューレより採血し、さらに剖検を行なった。PRC および PAC はラジオイムノアッ