慶應義塾大学学術情報リポジトリ
Keio Associated Repository of Academic resouces

Title	14α-メチルコレステロールの合成
Sub Title	
Author	高橋, 恭子(Takahashi, Kyoko) 宇佐美, 恵子(Usami, Keiko) 高橋, 環美(Takahashi, Tamami) 岡田, 智子(Okada, Tomoko) 森崎, 益雄(Morisaki, Masuo)
Publisher	共立薬科大学
Publication year	1987
Jtitle	共立薬科大学研究年報 (The annual report of the Kyoritsu College of Pharmacy). No.32 (1987.) ,p.133- 134
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=AN00062898-00000032-0147

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.

animals after a single oral administration of 25 or 50 mg/kg of the compounds. TD produced a gradual and sustained hypotension which lasted for about 48 hr. A maximal hypotensive effect by TD was observed at 24 hr after the administration and it was slightly smaller than that by enalapril (10 mg/kg). Among the derivatives tested, 7-O-ethyl-FC (7-EFC) had the most potent hypotensive action and sustained duration. FC and quarternary ammonium derivatives of TD had no discernible hypotensive effect. Plasma renin concentration was not affected by TD and 7-EFC, while it was significantly increased by enalapril. TD and 7-EFC had no effect on heart rate. These results suggest that TD and 7-EFC have an antihypertensive effect in SHRSP, and the mechanism of action is different from that of enalapril. Formation of active metabolite(s) appears to be responsible for gradual and sustained hypotensive action.

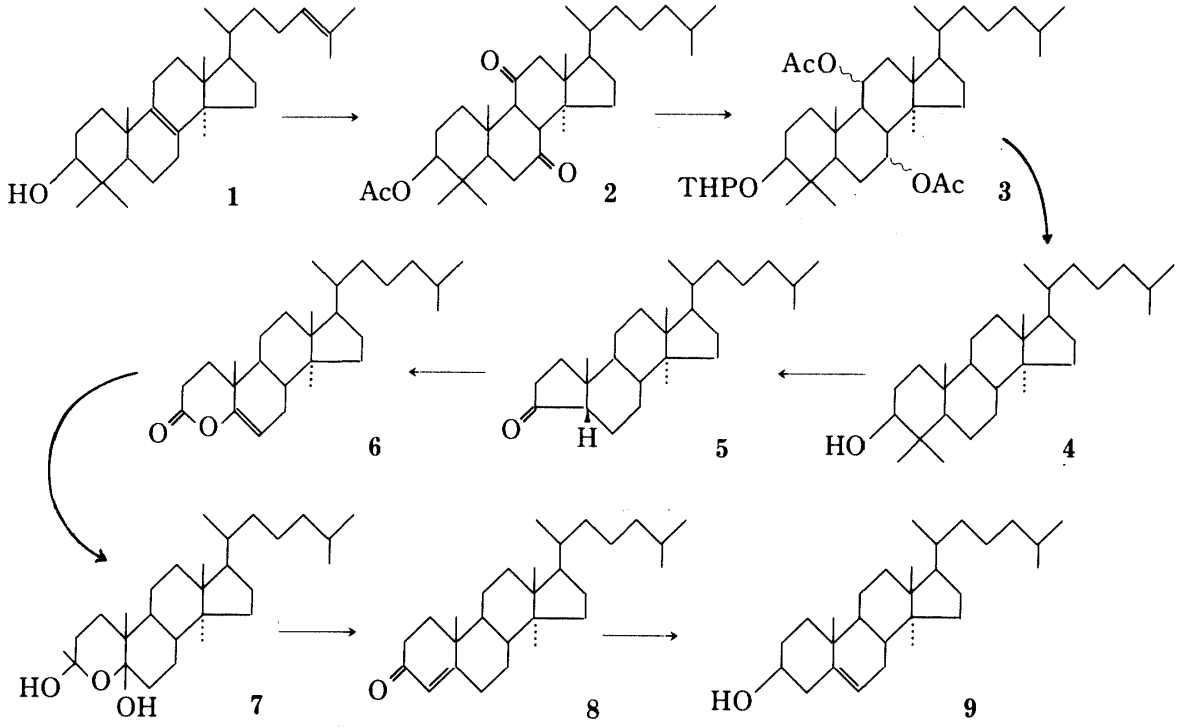
* 津村研究所

14α-メチルコレステロールの合成

高橋恭子，宇佐美恵子，高橋環美，岡田智子，森崎益雄

〔日本薬学会　第107年会（1987年4月，京都）で発表〕

〔**目的**〕　コレステロールの構造とその生体内機能との相関に関する研究に必要な表題化合物を合成する。



〔**方法・結果**〕 ラノステロール**1**の接触還元，アセチル化，クロム酸酸化，Zn/AcOH 還元で得たジケトン**2**を水解，THP エーテル化，ジメチルアミノピリジン存在下 Ac_2O でアセチル化して**3**とした。**3**を Na/HMPA/t-BuOH で脱アセトキシ化後酸処理してラノスタノール**4**を得た。**4**を PCl_5 による Wagner-Meerwein 転位後，オゾン分解，アルカリ処理して A-nor 体**5**を得，ついで CF_3COOOH による Baeyer-Villiger 酸化および Jones 酸化によりエノールラクトン**6**を生成。**6**の CH_3MgI との反応で**7**を経由して，アルカリ処理によりエノン**8**とする。**8**をエノールアセテートとし $NaBH_4$ 還元することにより 14α-メチルコレステロール**9**を合成した。**1**より 18 行程，通算収率 1—2%。

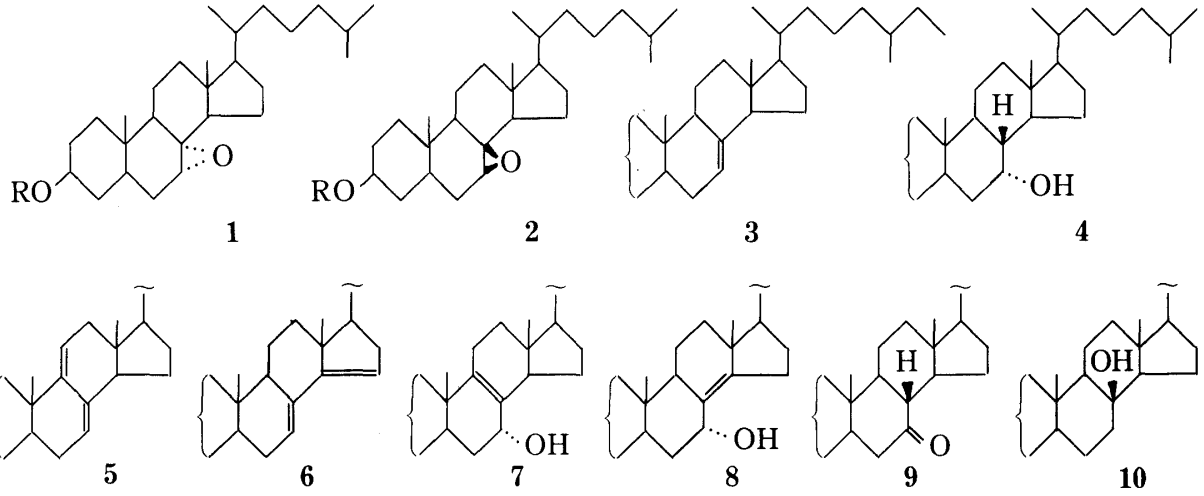
ステロイド 7,8-エポシキドの開環反応

丸山早苗，山口早苗，古屋美津子，森崎益雄

〔日本薬学会　第107年会（1987年4月，京都）で発表〕

〔**目的**〕 エポキシドの開環反応は一般に trans-diaxial 生成物を与えるが，ステロイド 7,8-エポキシドの場合はこの開環体は 8β-axial 体となり 10- および 13-Me と 1,3-diaxial 相互作用することになる。従って通常とは異なる反応が起る可能性がある。そこで 7α,8α-エポキシド**1**および 7β,8β-エポキシド**2**の還元剤，酸および塩基による反応を検討した。

〔**方法・結果**〕 Δ^7 体**3**を MCPBA 酸化し，主生成物であるα-エポキシド**1**と少量のβ-エポキシド**2**を得た。**1**はジアルキルアミドとは反応せず原料回収となった。還元反応として**1**を Li/$EtNH_2$ および $LiAlH_4$ と処理すると前者からは Δ^7 体**3**と 7α-OH 体**4**を与えたが，後者とはほとんど反応しなかった。**2**の $LiAlH_4$ 還元ではほぼ単一生成物として 8β-OH 体**10**を得た。**1**と酸（trace $H_2SO_4/CHCl_3$，aq. $HClO_4$/THF，および BF_3-Et_2O/benzene）との反応では，いずれの場合にもジエン**5**，**6**が生成したが，trace H_2SO_4 の場合にはアリルアルコール**7**，**8**，BF_3-Et_2O の場合には少量のケトン**9**も生成した。一方**2**と BF_3-Et_2O/benzene の反応ではジエンと 8β--H ケトン**9**（約 2 : 5）が生成した。



1 **2** **3** **4**

5 **6** **7** **8** **9** **10**