

# 抗不整脈作用を有する4,5-二置換1-ヒドロキシインドール誘導体群の開拓研究

著者	山田 康司
著者別表示	Yamada Koji
雑誌名	平成11(1999)年度 科学研究費補助金 奨励研究(A) 研究概要
巻	1998 1999
ページ	2p.
発行年	2016-04-21
URL	<a href="http://doi.org/10.24517/00060791">http://doi.org/10.24517/00060791</a>



# 抗不整脈作用を有する4,5-二置換1-ヒドロキシインドール誘導体群の開拓研究

Research Project

All

## Project/Area Number

10771245

## Research Category

Grant-in-Aid for Encouragement of Young Scientists (A)

## Allocation Type

Single-year Grants

## Research Field

Chemical pharmacy

## Research Institution

Kanazawa University

## Principal Investigator

山田 康司 金沢大学, 薬学部, 助手 (80272962)

## Project Period (FY)

1998 - 1999

## Project Status

Completed (Fiscal Year 1999)

## Budget Amount \*help

**¥1,800,000 (Direct Cost: ¥1,800,000)**

Fiscal Year 1999: ¥900,000 (Direct Cost: ¥900,000)

Fiscal Year 1998: ¥900,000 (Direct Cost: ¥900,000)

## Keywords

1-ヒドロキシインドール / 1-ヒドロキシトリプタミン / 1-ヒドロキシトリプトファン / 9-ヒドロキシ-β-カルボリン / 転移反応 / アルカロイド / 1-エトキシ-2-フェニルインドール / 光反応 / アミドカップリング

## Research Abstract

昨年度において、筆者は、4-および5-ニトロ-1-ヒドロキシインドールの合成に成功し、これらが、アミドカップリング機能を持つこと、その能力が、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールと同等であることを認めた。また、当研究室の仮説では、1-ヒドロキシトリプトファンが生体内に存在し、上述の機能を果たしている可能性をも示唆している。そこで本年度は、1. 本仮説の検証を目的として、様々な構造を持つ、Nb-置換1-ヒドロキシトリプタミン、1-ヒドロキシトリプトファン誘導体の合成を行った。さらに得られた化合物を酸で処理すると、インドール化学では極めて珍しい求核置換反応が5位で位置選択的に、しかも効率良く起こることを見出した。この新反応を利用することにより、従来極めて得がたかった、5位に酸素官能基やハロゲンを持つトリプタミン、トリプトファン誘導体が簡単に合成できるようになり、合成化学上有益な成果を得た。2. さらに、9-ヒドロキシ-β-カルボリンの最初の合成にも成功した。これら化合物と酸との反応では、骨格の転位反応が起こり、3,3-二置換オキシインドールを生成するという、約10年に渡り検討されてきた、仮説で予言されていた、新反応ついに発見することが出来た。3. 以上の1、2の事実を、もしも天然物として1-ヒドロキシインドール化合物が存在したとしたら、従来のアルカロイド抽出操作では、変化体のみが得られるという可能性を示唆している。天然物化学領域に、今後の重要な検討課題を提示することができた。未開拓領域で、新知見の宝庫である1-ヒドロキシインドール化合物群のについて、引き続き基礎研究を展開中である。

# Report (2 results)

1999 Annual Research Report

1998 Annual Research Report

# Research Products (4 results)

All	Other
All	Publications

[Publications] M.Hasegawa: "A novel methodology for preparing 5-chloro- and 5-bromo-tryptamins and tryptophans,and its application for the ---"Heterocycles. 51(12). 2815-2821 (1999) ▼

[Publications] M.Somei: "Preparation and a novel rearrangement reaction of 1,2,3,4-tetrahydro-9-hydroxy-β-carboline, and their applications ---"Heterocycles. 53(1). 7-10 (2000) ▼

[Publications] M.Somei: "Synthesis of 1-hydroxytryptamines and serotonins having fattyacyl or(E)-3-phenylpropenoyl derivatives as a Nb-substituent and a novel homologation-" Heterocycles. 48(6). 1117-1120 (1998) ▼

[Publications] K.Yamada: "Photo-induced rearrangement of 1-ethoxy-2-phenylindole" Heterocycles. 48(12). 2481-2484 (1998) ▼

URL:

Published: 1998-03-31 Modified: 2016-04-21