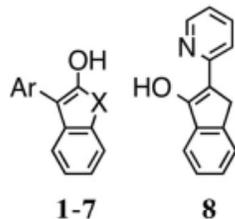


# 28S-am07S

新規抗酸化剤環状 arylvinyl alcohol 類のデザインと合成

○藤田 亮輔<sup>1</sup>, 高橋 恭子<sup>1</sup>, 安田 大輔<sup>1</sup>, 中村 成夫<sup>2</sup>, 大江 知之<sup>1</sup>, 増野 匡彦<sup>1</sup> (<sup>1</sup>慶應大薬,  
<sup>2</sup>日本医大)

【目的】我々は新規抗酸化剤の創製を目指し、pyridinyl-vinyl alcohol 類 **1-3** がアスコルビン酸 (AsA) と同等以上の DPPH ラジカル消去活性を示すことを明らかにしている。今回は活性の向上および構造活性相関の解明を目的とし、**1** のピリジン環への置換基導入、もしくはピリジンを他のヘテロ環に置換した 3-heteroaryl-2-indenol 類 **4-7** および **1** の位置異性体 **8** を新たにデザイン・合成し、その抗酸化活性を評価した。【方法】一連の化合物は、対応するインデノールアニオンとヘテロ環とのパラジウム触媒を用いたクロスカップリング反応により合成した。各化合物の DPPH ラジカル消去の二次反応速度定数をストップフロー法を用いて測定した。H<sub>2</sub>O<sub>2</sub> 誘発酸化ストレスに対する細胞保護効果を HL-60 細胞を用いて評価した。【結果と考察】DPPH ラジカル消去活性は **6>7≈5>3>2>1>4>AsA>8** の順であった。このことから活性発現には 1) 共鳴系が広いこと、2) Ar に電子求引性のヘテロ環があること、3) X にヘテロ原子があることが有利であることが示唆された。環状 arylvinyl alcohol 類は細胞保護効果も脳保護薬エダラボンと同等に高く、新規抗酸化剤のリード化合物として有用であると考えられる。



	Ar	X
<b>1</b>		CH <sub>2</sub>
<b>2</b>		O
<b>3</b>		S
<b>4</b>		CH <sub>2</sub>
<b>5</b>		CH <sub>2</sub>
<b>6</b>		CH <sub>2</sub>
<b>7</b>		CH <sub>2</sub>