

5 - フェニルピリミジン類の合成と抗炎症作用

日比野 俐, 乃美和彦, 新谷陽子, 杉野栄一, 藤岡晴人,
門脇修一郎*, 小田切優樹**

Drug Design and Delivery, 5, 49 - 55 (1989).

Synthesis and Anti-inflammatory Activity of 5-Phenylpyrimidines

Satoshi HIBINO, Kazuhiko NOMI, Yohko SHINTANI,
Eiichi SUGINO, Haruto FUJIOKA, Shuichiro KADOWAKI*
and Masaki OTAGIRI**

ABSTRACT Twenty one 5-Phenylpyrimidines were prepared by condensation of appropriate phenylmalonaldehyde equivalents with amidines. The anti-inflammatory activities of the compounds were measured in rats, using the carrageenin-induced paw edema assay, enabling conclusions regarding the relationship of structure and anti-inflammatory activity. The most active compounds were 5-(2-chlorophenyl)-2-methyl-, 5-(3-chlorophenyl)- and 2-amino-5-(4-chlorophenyl) pyrimidines having a chlorine atom in the phenyl ring.

抄録 α -フェニル- β -スルフェニル α , β -不飽和アルデヒド類は不安定なフェニルマロンアルデヒドと同等な複素環の合成原料である。これらの合成法について、ベンズアルデヒド類から Wittig 反応によりビニルスルフィドとし、更に Vilsmeier により三行程で合成することができた。複素環への変換はピラゾール及びピリミジン類の合成に好結果を与えることが判明した。その中で、21種類のピリミジン類について抗炎症作用を検討したところ (Winter らのラットによるカラゲニン足蹠浮腫抑制試験により測定), フェニルブタゾンと同等か、それ以上の作用を有するピリミジンが三種類見いだされた。活性の増強への著るしい影響は、フェニル基上に塩素原子を有することが必須条件となることが明らかとなった。

* Research Laboratory, Mitsubishi Yuka Co. Ltd. 三菱油化研究所

** Faculty of Pharmaceutical Sciences, Kumamoto University 熊本大学薬学部