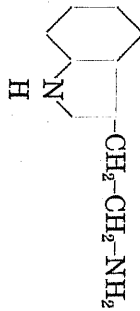


理學博士星野敏雄君の「インドール誘導體の合成的研究」
に對する授賞審査要旨

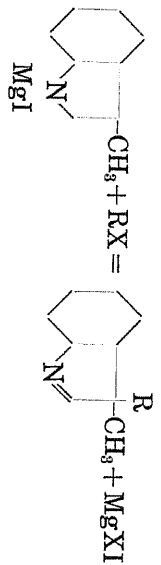
著者はインドール誘導體の合成に従事すること已に十年に近く其の間、

- (1) 先づグリニアル反應を用ひて諸種のインドール誘導體を製したりしが、クロルアセトニトリル $\text{Cl}-\text{CH}_2-\text{CN}$ を用ひてトリプタミン



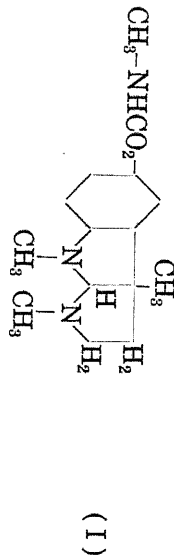
を合成せるは就中最も注目に値するものなり。

- (2) 著者は尙此のグリニアル反應の機構につきて考察し、之は共軛二重結合に於て1、4、加成反應と解すべしとなし、スカトール—マグネシウム沃化物にハロゲン化アルキル RX の作用によりてインドレニン誘導體の生成を見出して以上の見解を實證せり。即ち

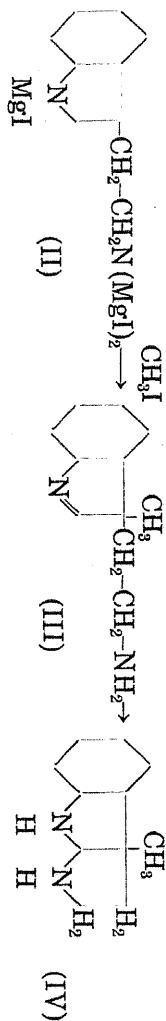


スクアターレンマグネシウム沃化物 イソドレニン誘導體

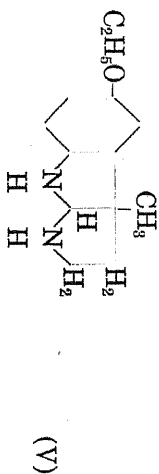
(3) 英國の化學者バージャー、ステッドマン及びロビンソン氏等によりカラバル豆のアルカロイドにして瞳孔縮小作用あるエゼリン (Eserin-Physostigmin) の構造式が(1)の如く推測せられ、



ロビンソン氏等によりて其の合成が企圖せらるゝや、著者も亦前二項(1)、(2)の反應を利用して其の合成を行はんとせり、即ちトリプタミンより誘導したるグリニアル化合物(II)に沃化メチルを作用せしめたり、然るに左の如く先づインドレニン誘導體(III)を生ずるも、之は直に分子内に於て游離アミノ基を加成してエゼリンに特有なる核を有するデノルデスオキシエゼロリン(IV)を生ずることを見出したる、即ち反應は豫期以上に進行し更に一段階を飛躍せり。

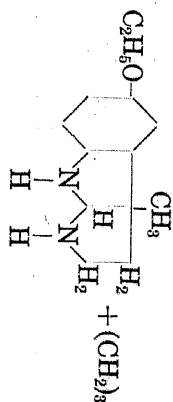


著者は同様にしてチノルエゼントール (V) を合成せり。



之れ甚だ興味ある發見にして、エゼリン環が天然に生成する場合の機構亦之に類するものあるべしと察せらる。

(4) 次に著者は (V) の物質の兩個のイミド基 $\text{N}=\text{H}$ のメチル化を行ひ、エゼントールを得んとしたるが、チノルエゼントール游離鹽基に沃化メチルを作用せしむるときは、常にメチルエゼントール (VI) を得て目的を達せず。

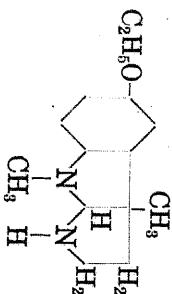


(VI)

メチルエゼレトール

本品はロビンソン氏が全く別途の方法により合成してエゼレトール (X) を得たりと誤信したるものにして、著者によりて其のエゼレトールに非ずしてメチルエゼレトールなることを指摘せられたるものなり。

著者はまた (V) の物質の鹽酸鹽を沃化メチルを以て處理するときは、ベンゼン核に近きイミド基のみメチル化せられノルエゼレトール (VII)



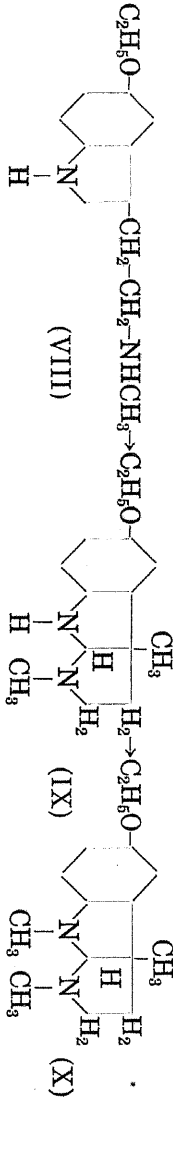
(VII)

ノルエゼレトール

を生ずることを發見せり、之によりてデノルエゼレトールのメチル化によりては、常にメチル化に過

不足を生じエゼレトールを得られざることを知れり。

(5) 是に於て著者は方向を轉じ苦心研究の結果、遂に5.エトキシトリプタミンのアミド基をヒン
 スベルグ法によりてモノメチル化することに成功し (VIII) の物質を得、之をグリニアル化合物に
 變じ、(3)項に記載せる方法に従びイソノルエゼレトール (IX) となし、之を(4)項後半に記載せる方法
 に従ひメチル化しエゼレトール (X) に、而て更に之を分割して終にd及びlエゼレトールに到達
 したり。

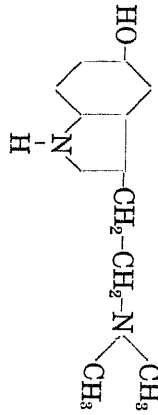


エゼレトール (X) よりエゼリン (I) に變化せしむることは已知の事項に屬するを以てエゼレトール (X)
 の合成によりてエゼリンの合成は完成せられたるなり。

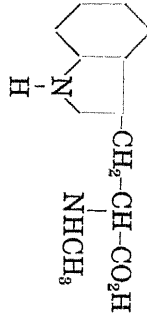
即ち此の如く著者はロビンソン氏の誤謬を指摘し、氏に先じてエゼリンの合成に成功するを得たり。
 然れども惜かな米國の化學者ジュリアン及びピクル兩氏はオキシインドール誘導體より出發してエ
 ゼレトールの合成に成功し、著者に先つこと約半歲其の結果を公にせり、然れども此等兩人の研究に

は屢著者の研究を参考とし、之によりて啓發せらるゝところ少からざるを認む。

(6) 著者はエゼリン合成に際し前諸項に説明せる以外に種々の關聯したる研究を行ひ、エゼリン合成のために参考となせり。而て其の知識を利用して他のインドール誘導體の合成又は構造闡明に資したるもの少なからず、今左の二例を擧げ其の詳細を略して結果のみを述べれば、即ち藜毒の鹽基性成分の一なるプフオチニン



の合成を行ひたること及びタウアヅキの成分アブリンの構造式を



の如く決定したるがごとし。

之を要するに著者はインドール誘導體の反應機構の考察より入りて、遂に進みてエゼリンの合成等に成功するに至るまで多くの興味ある新事實を發見し、よく英米の學者と角逐して其の目的を達した

るは有機合成化学上の學識技能の卓絶せるを示すものなりと認む。