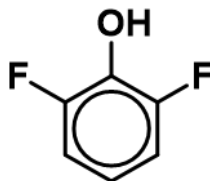


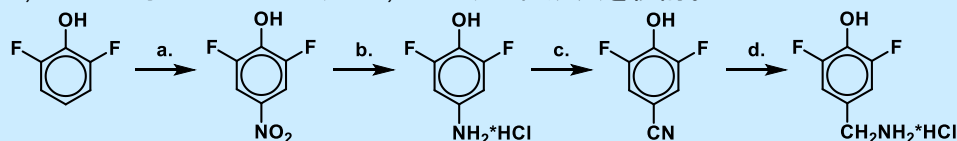
2,6-Difluorophenol

2,6-ジフルオロフェノール (abb. 2,6-DFP)



Purity	97%
CAS Number	28177-48-2
Molecular Formula	C ₆ H ₄ F ₂ O
Molecular Weight	130.09

GABA はノルアドレナリン分泌抑制、副交感神経優位化により興奮、イライラの抑制効果を示すことが知られている。GABA 受容体の大きな割合を占める GABA_A 受容体、GABA アミノ基転移酵素へ結合する GABA の生物学的等価構造として 2,6-DFP から脂質溶解性に有利なフッ素を有する 4-アミノメチル-2,6-ジフルオロフェノール (abb.;ADFP) の合成法を検討。



a. HNO₃ + CH₃COOH at 15-20°C, b-1. H₂ + Pd/C, b-2.HCl, c-1. NaNO₂+HCl at 0°C, c-2. CuCN+KCN at 50°C; Yd 40%, d-1. BH₃+THF reflux, d-2. 6N-HCl reflux; Yd 71%

Application

次いで卵母細胞の GABA 受容体を用いて ADFP の拮抗阻害剤としての働きを調査。その結果 ADFP 単独では GABA 受容体への顕著な結合性を示さなかったが、GABA/ADFP 併用では GABA の上記受容体への結合性を約 30%抑制することを (GABA の生物学的等価構造としては初めて) 見出した。

表-1 卵母細胞の GABA 受容体への GABA, ADFP 投与時の結合電流値

	10μM-GABA	100μM-ADFP	100μM-ADFP + 10μM-GABA
卵母細胞 電流値 (nA)	12nA	0	8nA

電極間電位: -60mV

Bioorganic & medicinal Chem. Lett. 9, 1999, p3093-3098

J. Med. Chem. 1999, 42, p329-332

Properties:

Appearance	Solid
Boiling point, °C	59-61
Melting point, °C	38-41

Capacity:

-