

[Japan. J. Pharmacol., 33, 1215 (1983)]

**Pharmacological Studies on Newly Synthesized Anti-allergic Agents,  
2-Methyl-3-piperidino- $\beta$ -propionaphthone Hydrochloride (KZ-111) and  
3-Isobutyryl-2-isopropylpyrazole- [1, 5-a] Pyridine (KC-404)**

HIROICHI NAGAI, TEIJI IWAMOTO, TAKESHI NISHIYORI,  
TAMOTSU TAKIZAWA, HIROSHI TSUCHIYA, AKIHIDE KODA

新しい抗アレルギー剤, 2-methyl-3-piperidino- $\beta$ -propionaphthone  
hydrochloride (KZ-111) および 3-isobutyryl-2-isopropylpyrazole-  
[1, 5-a] pyridine (KC-404) の薬理学的研究

永井博式, 岩本禎司, 西依 健, 滝沢 保, 土屋博司, 江田昭英

KZ-111, KC-404 および FPL-55712 の実験的アレルギー反応に及ぼす影響を検討した。FPL-55712 は経口投与では無効であったが静脈内投与では PCA 反応を抑制した。KC-404 および KZ-111 の PCA 抑制作用は反応惹起 2 時間前の投与により最大となった。KC-404 および FPL-55712 は感作ラット腹腔 mast cell からの histamine 遊離を抑制しなかったが  $10^{-4}$ g/ml の KZ-111 は抑制作用を示した。これら 3 種の化合物は calcium ionophore A23187 による mediator 遊離の抑制しなかった。KC-404 および KZ-111 は LTD<sub>4</sub> に対する拮抗作用を示したが、FPL-55712 の拮抗様式とは異なる可能性が示された。K<sup>+</sup> で depolarize したモルモットの腸管平滑筋の CaCl<sub>2</sub> による収縮は KC-404 および KZ-111 によって抑制された。モルモットの SD 反応はいずれの化合物によっても抑制されたが、実験的喘息は KC-404 および KZ-111 によって抑制された。

[J. Pharm. Dyn., 6, 874 (1983)]

**Immunopharmacological Studies on Mydocalm and Related Compounds  
as an Antagonist of Slow Reacting Substance of Anaphylaxis (SRS-A)**

HIROICHI NAGAI, NAOSUKE MATSUURA, NATSUKI SATO,  
AKIHIDE KODA, SHIGEKATSU KOHNO\*

Slow reacting substance of anaphylaxis (SRS-A) 拮抗物質としての  
mydocalm およびその関連化合物の免疫薬理学的研究

永井博式, 松浦直資, 佐藤夏樹, 江田昭英, 河野茂勝\*

Mydocalm およびその誘導体を用い, slow reacting substance of anaphylaxis (SRS-A) に対する拮抗作用を *in vitro* において検討した。その結果, mydocalm, 誘導体 As-5 および As-14 は SRS-A に対する強力な拮抗剤であることを見出した。これら 3 種の化合物はラットおよびモルモットの homologous passive cutaneous anaphylaxis (PCA) を抑制したが, モルモットの heterologous PCA を抑制しなかった。さらに, 誘導体 As-5 はラット腸管膜 mast cell からの histamine 遊離および同 mast cell の脱顆粒をも抑制した。これに対して, mydocalm はこれらの反応を抑制しなかった。同種 IgE 抗体で受動的に感作したモルモットの実験的喘息はこれら 3 種の化合物の経口投与によって著明に抑制された。

\* 京都薬科大学薬理学教室