Journal of the Pharmaceutical Society of Japan

Editor: A. OGATA

YAKUGAKUZASSHI

Subeditor: S. TAKAGI

T. Kariyone, E. Wakabayashi und Y. Tarazaki: *On the cultivation of various species of Datura and preparation of alkaloids from the seeds.*

T. Kariyone, T. Sato und I. Terazaki: *Untersuchungen über die Insekten tötenden Wirkungen von japanischen Volkswurm-mittel. (Vorläufige Mitteil.)*

T. Ogata und T. Sano: *Über die physiologische Wirkung des Brommagnesiums (II).*

T. Hachiya und J. Nishimura: *Action of some aromatic sulphocompounds upon pathogenic fungi.*

The authors have prepared some aromatic sulphocompounds (thiolacids, Thioureas, and thiourethanes), and examined their action on pathogenic fungi.

The fungi have been inoculated on the maltose-agar media containing a fixed quantity of the chemicals of different dilutions and kept at 20° for 10 days. Then the undeveloped samples have been transferred to fresh media without the chemicals and again kept at 20° for 10 days. Thus we have observed the fungistatic and fungicidal actions of the chemicals.

Fungi examined:

1. Trichophyton interdigitale
2. Trichophyton umbilicatum
3. Trichophyton niveum denticulatum Sabourand
4. Trichophyton pedis
5. Trichophyton gypard
6. Achorion Quinckeacenum

藥 學 雜 誌

第五十二卷 第九號 (累號六百七) 昭和七年九月發行

— 報 文 —

チヨウセンアサガホ屬各種の栽培竝に アルカロイド製造試験

刈 米 達 夫

若 林 榮 四 郎

寺 崎 勇

(内務省衛生試験所藥用植物部)

(昭和 7 年 7 月 11 日受理)

T. Kariyone, E. Wakabayashi, and Y. Terasaki; On the Cultivation of various species of *Datura* and preparation of alkaloids from the seeds.

チヨウセンアサガホ屬(*Datura*)諸種植物の種子はアトロピン及びスコボラミンの製造原料に用ひられ本邦に於ても數年前其製造行はれ福島縣下にシロバナ洋種チヨウセンアサガホ *Datura Stramonium* 及び種名不詳の一種大規模に栽培されたることあり。余等は同屬植物下記六種に就て其栽培竝に製藥上の得失に就て比較研究せり。

チヨウセンアサガホ *Datura alba* Nees

ハリナシチヨウセンアサガホ *D. inermis* Facq.

ケチヨウセンアサガホ *D. Metel* L.

アメリカチヨウセンアサガホ *D. meteloides* D.C.

白花洋種チヨウセンアサガホ *D. stramonium* L.

洋種チヨウセンアサガホ *D. tatula* L.

是等の六種の種子に就てアルカロイド及び脂肪含量を測定するに次の如し。

	主アルカロイド	アルカロイド含量 (%)	脂肪含量(%)
チヨウセンアサガホ	スコボラミン	0.32	6.69
ケチヨウセンアサガホ	”	0.28	12.87
アメリカチヨウセンアサガホ	”	0.27	15.52
洋種チヨウセンアサガホ	ヒヨスチアミン	0.17	18.1
白花洋種チヨウセンアサガホ	”	0.20	17.06
ハリナシチヨウセンアサガホ	”	0.15	16.55

是等に就て栽培成績を表示すれば次の如し

	種子反収(Kg)	栽培上の得失
チヨウセンアサガホ	68	開花期晩く降霜期迄に成熟せざる果實多し。 收量稍、良きも果皮破れて種子落ち易し。 收量少く實際上の栽培に適せず。
ケチヨウセンアサガホ	77	
アメリカチヨウセンアサガホ	15	
洋種チヨウセンアサガホ	150	栽培上著しき缺點を認めず。
白花洋種チヨウセンアサガホ	143	前種と全く同様なり。
ハリナシチヨウセンアサガホ	—	果實に刺無きを以て採收に便なり。收量稍、劣る。

上記の成績を綜合するにアトロピン原料としては洋種チヨウセンアサガホ及び白花洋種チヨウセンアサガホ,スコボラミン原料としてはケチヨウセンアサガホ最も適せり。

各種脂肪油の性状次の如し

	色	比重(15°)	酸 数	鹼化数	ヨード数
チヨウセンアサガホ	帶綠黃色	0.9233	6.16	179	111.4
ケチヨウセンアサガホ	„	0.9239	8.07	182	123.4
アメリカチヨウセンアサガホ	„	—	—	—	—
洋種チヨウセンアサガホ	淡 黄 色	0.9239	5.52	185	120.5
白花洋種チヨウセンアサガホ	„	0.9243	10.2	183	122.9
ハリナシチヨウセンアサガホ	„	0.9038	2.96	168	100.1

(一) 白花洋種チヨウセンアサガホ種子より硫酸アトロピンの製造

(1) ヒオスチアミンの製造

白花洋種チヨウセンアサガホ種子を粉碎し 10kg にガソリン 4L. を加へ一夜放置後水壓器にて壓搾し、残渣に更にガソリン 3L. を加へ壓搾し、脱脂末 8.4kg を得たり。之に 10%炭酸ソーダ溶液 5L. を加へて均等に浸潤せしめ風乾後約 40L. のベンゾールを 3 回に分ち温浸し、ベンゾール液を合併濾過し初めは常壓、次に減壓の下にベンゾールを回収し濃稠ならざる程度に濃縮し 5%硫酸 1.5L. を加へ数時間攪拌したる後酸層を分取濾過し、30%強アンモニア水にて弱酸性に至るまで中和し、少量のクロロホルムにて洗滌し強アンモニア水 300cc を加へ、クロロホルム 450cc を 3 回に分ち加へよく振盪し、クロロホルム層を分取し、燒芒硝にて脱水したる後クロロホルムを回収し放冷すれば粗ヒオスチアミンの結晶析出す。結晶を吸引濾過し母液を濃縮すれば更に第二次結晶析出す。

	收量(g)	收得率(%)	Fp.
第一回結晶	17.4	0.174	102°
第二回結晶	6.0	0.06	52~80°

(2)アトロピンに轉化

此の操作より後の工程は大體に於て臨時製藥報告硫酸アトロピン製造試験成績の方法により。 (本誌大正 4 年 847; 5 年 643; 12 年 55 参照)

乾燥アトロピン 17.4g を無水アルコール 90cc に溶解し、無水アルコール製苛性ソーダ溶液 (0.4%) 85cc を加へ 15° にて 1 時間放置したる後、炭酸ガスを通じ此處に析出せる炭酸ソーダを濾過す。濾液を減壓にて濃縮し、冷後 5~6 倍の水を加ふれば翌日に至りアトロピンの結晶析出す、之を吸引濾過す。

收量 14g Fp. 113°

ヒオスチアミンの約 80% がアトロピンに轉化せり: 同様にして前記第 2 回結晶より 2.0g Fp. 110° のアトロピンを製す。

(3)硫酸アトロピンの製造

乾燥アトロピン 16g を粉末とし對應量の冷無水アルコール製硫酸 (10%) 中に溶解したる後アルコールを溜去し不純物を去る爲に残留物を沸騰アセトン 60g を以て溫浸し吸引濾過する事 2 回にして残留せる結晶を加溫し附着せるアセトンを去り 5 倍量の無水アルコール中に熱溶し濾過後沸騰アセトンを徐々に加へて放冷し生ずる結晶を濾取し乾燥す。

收量 10.0g Fp. 191°

原料よりの收得率 0.1% なり。

(二)ケチヨウセンアサガホ種子よりブロム水素酸スコボラミンの製造

(1)スコボラミンの製造

ケチヨウセンアサガホ種子を粉碎し 10kg にガソリン 5L. を加へて一夜放置後水壓器にて壓搾し殘渣に更にガソリン 3.5L. を加へ壓搾し、脱脂末に 10% 炭酸ソーダ溶液 8L. を加へ浸潤せしめ爾後ヒオスチアミンの製造と同様の操作にて褐黃色シロツブ狀の粗スコボラミンを得。

收量 20g 0.2%

(2)ブロム水素酸スコボラミンの製造

粗スコボラミン 20g を同量の無水アルコールに溶解し無水アルコール製ブロム水素酸 (52%) を以て中和す、之に結晶核を加へ氷室に放置すれば漸次結晶析出す。之を吸引濾過し、結晶をアセトンにて洗滌したる後同量の水に溶解し炭末を加へ加溫濾過し減壓にて濃縮し氷室に放置すれば結晶析出す。結晶を吸引濾過し、母液を濃縮すれば第二次結晶析出す。

	收量(g)	收得率(%)	融 點
第一回結晶	4.7	0.049	193~194°
第二回結晶	0.5	0.005	180°

第2回結晶は更に精製し合計 5g の藥局方適合のブロム水素酸スコボラミンを得たり。原料よりの收得率 0.05% なり。

(四) 種子油に就て

上記アルカロイド製造副産物たる種子油は其量白花洋種チヨウセンアサガホに於て 17%、ケチヨウセンアサガホに於て 13% に達するを以て其利用上アルカロイドを含有するや否やを確かめ置かざるべからず。故に其脂肪油 1 滴を猫の眼に點じ瞳孔の散大を検す、尙對照試験としてアトロピン及スコボラミンの遊離鹽基 0.01% 及び 0.005% を含有する脂肪油に就て試験を行へり。

	猫の眼に對する反應
白花洋種チヨウセンアサガホ油	—
同上、アトロピン 0.005% 含有	—
同上、アトロピン 0.01% 含有	+
ケチヨウセンアサガホ油	—
同上、スコボラミン 0.005% 含有	—
同上、スコボラミン 0.01% 含有	+

猶脂肪油 20g をエーテル 50cc にて稀釋し稀鹽酸 10cc にて 1 回、次に 5cc にて 2 回振盪し酸性液を合しアンモニア水 15cc を加へてアルカリ性としクロロホルム 10cc にて 1 回次に 5cc にて 2 回振盪しクロロホルムを合して蒸溜し其殘留物に就て次の試験を行ひたり。

(1) 殘留物に就て Vitali 反應

(2) 殘留物のマイエル試薬に對する反應

對照試験は前と同じくアルカロイド 0.005% 及 0.01% 溶液に就て試みたり。

	マイエル試薬	ビタリ反應
白花洋種チヨウセンアサガホ油	—	—
同上、アトロピン 0.005% 含有	+	+
同上、アトロピン 0.01% 含有	+	+
ケチヨウセンアサガホ油	—	—
同上、スコボラミン 0.005% 含有	+	+
同上、スコボラミン 0.01% 含有	+	+

以上の結果によればチヨウセンアサガホ種子油にはアルカロイドの含有を認むるを得ず、石鹼原料等に使用し有害の恐れ無かるべし。