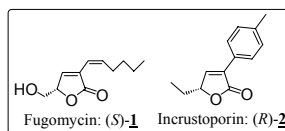


31-1092

抗真菌性物質 Fugomycin および各種立体異性体の合成と生物活性

○荻野 弘幸¹, 笹井 志都香¹, 内呂 拓実¹ (¹東京理大薬)

【目的】 Fugomycin (**1**) は 1997 年に *Pseudomonas aureofaciens* から単離された抗真菌性ブテノリドであるが、その作用機序は未だ明らかにされていない。当研究室では、**1** と類似した化学構造をもつ Incrustoprin (**2**) の γ 位の不斉炭素原子に由来する両エナンチオマーを合成し、これらの抗真菌活性に全く差異が認められないことを明らかにしている。そこで本研究では、**1** の両エナンチオマーおよび α 位の側鎖中に含まれる二重結合の幾何異性体等の各種立体異性体を合成し、その抗真菌活性について検討することにより、より強力な活性をもつ新規化合物を設計していくための新たな知見を得ることを目的とした。



【方法・結果】 グルタミン酸の両エナンチオマーを出発原料として用い、これを既知の方法により光学活性な γ -ヒドロキシメチル- γ -ブチロラクトンに導いた後、 α -フェニルチオブテノリドを経由して α -スタニルブテノリドとした。これと別途調製した (*Z*)-1-ヨード-1-ヘキセンとの Stille Coupling 反応により、**1** の両エナンチオマーの合成を達成した。さらに Stille Coupling 反応の基質として、(*E*)-1-ヨード-1-ヘキセンを用いることにより、**1** のトランス異性体の両エナンチオマーも合成することができた。現在、合成した各化合物の抗真菌活性について検討している。

