

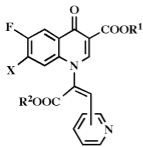
28P-am157

Quinolone Analogues. 抗マラリア活性を示すキノロンアナログの合成

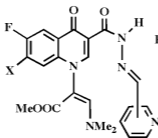
○倉沢 嘉久¹, 吉田 君成¹, 山崎 直毅¹, 梶 英輔², 佐々木 健二³, 日和佐 佳子³, 柄本 晶子³, 福森 正紘³(¹いわき明星大薬, ²北里大薬, ³岡山大薬)

[目的]我々は 2007 年の複素環化学討論会に於いて、N1-位側鎖に pyridyl 基を有する Quinolones (1)の誘導體(R¹=R²=Et, X=H, 4-pyridyl)が、抗マラリア活性を示すことを報告した。また、C3-位側鎖に pyridyl 基を有する Quinolones (2)は抗マラリア活性を示さなかったが(2008年、複素環化学討論会)、今回合成した Quinolones (3)には抗マラリア活性を示す化合物が複数含まれている事が判った。これらの合成とスクリーニングデータについて報告する。

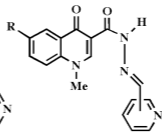
[結果]Quinolone-3-carboxylate (4)を既知方法で合成した。メチル化及びヒドラジドへの誘導を経た後に Quinolones (3)を得た。



1: X = H, Cl, R¹, R² = H, Me, Et



2: X = H, Cl



3: R = F, CF₃



4: R = F, CF₃