

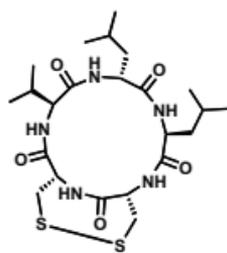
27P-am164

Malformin C の類縁体合成と構造活性相関の解明

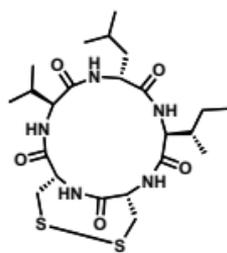
砂塚 敏明^{1,2}, 小嶋 康裕², 長井 賢一郎^{1,2}, 門馬 壮一², 乙黒 一彦³,
石山 亜紀³, 大村 智¹(¹北里大生命研, ²北里大院感染制御, ³北里大基礎研)

【背景・目的】 Malformin C (**1**)は最近、北里研究所において G2 チェックポイント阻害活性を有する物質のスクリーニングにおいて真菌 *Aspergillus niger* FKI-2342 株の培養液より単離された天然物である。また **1** は、以前に広域抗生物質として見いだされている。一方で、天然からの供給が乏しい **1** は新たな活性探索の観点から様々な抗感染症活性のスクリーニングに供するには限界があった。そこで我々は、**1** の液相全合成を達成することで生物活性試験に提供し、**1** が新たに抗マラリア活性と抗トリパノソーマ症活性を有することを明らかにしたので、それらの構造活性相関を解明するために簡便な類縁体合成を目的とした **1** の固相合成法を確立し、類縁体の合成を行った。

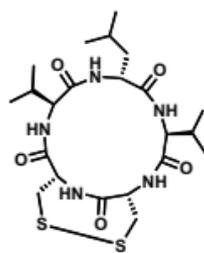
【方法・結果】 確立した固相合成法を用いて **1** の類縁体を合成し、ライブラリー構築を行った。その結果、構造活性相関の情報を得るとともに **1** の活性を超える類縁体を見いだすことができた。



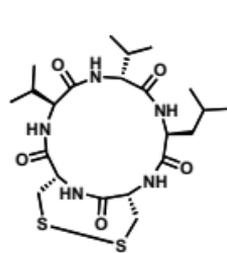
Malformin C (1)



Malformin A1



Malformin A2



Malformin B2