

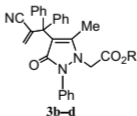
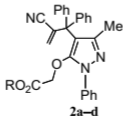
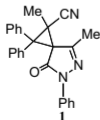
# 27P-am234

スピロシクロプロパンピラゾロン類から合成された新規ピラゾール誘導体の抗真菌活性について

○益本 英一<sup>1</sup>, 丸岡 博<sup>1</sup>, 鹿志毛 信広<sup>1</sup>, 岡部 史<sup>1</sup>, 西田 翔<sup>1</sup>, 吉村 友希<sup>1</sup>, 田中 玲子<sup>2</sup>, 見明 史雄<sup>1</sup>, 藤岡 稔大<sup>1</sup>, 山方 健司<sup>1</sup> (<sup>1</sup>福岡大薬, <sup>2</sup>千葉大真菌医)

【目的】先に我々は、抗真菌活性を有するスピロシクロプロパンピラゾロン類の簡易合成法を見出した。<sup>1)</sup>さらなる新規ヘテロ環化合物の合成ならびにその薬理学的作用などを明らかにする目的として、今回は、スピロ化合物から導かれた新規ピラゾール誘導体の抗真菌活性を評価したので報告する。

【実験および結果】スピロシクロプロパンピラゾロン **1** と  $\alpha$ -クロロエステル類を炭酸カリウム存在下で反応させると、シクロプロパン環の開裂が生起し、*O*-置換ピラゾール誘導体 **2a-d** が得られること、さらにその反応条件にヨウ化ナトリウムを添加することにより *N*-置換ピラゾール誘導体 **3b-d** が生成することを明らかにした。7種類の **2a-d** および **3b-d** に対する真菌類 *S. cerevisiae* および *C. albicans* の薬剤感受性を NCCLS (米国臨床検査標準委員会) 標準法に従って、MIC (最小発育阻止濃度) で判定したところ、すべての化合物 **2a-d** および **3b-d** に抗真菌活性が認められた。従って、生物活性発現への期待が予測される。



2,3	R
a	Me
b	Et
c	Pr <sup>i</sup>
d	Bu <sup>t</sup>