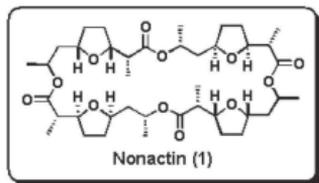


29M-am05

イオノフォアマクロライドの不斉全合成ならびに白血病細胞に対する増殖抑制効果

梅崎 優真¹, 大内 瑞恵¹, 佐藤 卓², 長原 礼宗², ○殿井 貴之¹, 椎名 勇¹
(¹東理大理, ²電機大理工)

【目的】ノナクチン(1)は放線菌(*Streptomyces griseus*)より単離された大環状ラクトンであり、ノナクチン酸の両鏡像異性体 2 分子ずつから形成されるメソ化合物である。我々は当研究室で開発した 2-メチル-6-ニトロ安息香酸無水物(MNBA)をノナクチン酸誘導体の連結ならびにラクトン形成反応に活用しノナクチンおよび類縁体を体系的に合成した後、合成品の薬理活性調査を行うこととした。



【方法と結果】光学活性な 1,3-butandiol を出発原料として用い、ノナクチン酸保護体を調製した。MNBA を用いて得られたフラグメントを順次連結することで 4 量体とした後、保護基の除去を行い環化前駆体であるセコ酸へ導いた。続いて MNBA を用いてラクトン形成反応を行うと室温条件下で閉環反応が進行し、目的のノナクチンを得ることが出来た。また、同様の手法を駆使することで様々な類縁体の合成にも成功した。得られた化合物の Jurkat および HL60 細胞への細胞傷害性評価を行ったところ、構造の違いによる活性の差異が認められた。

