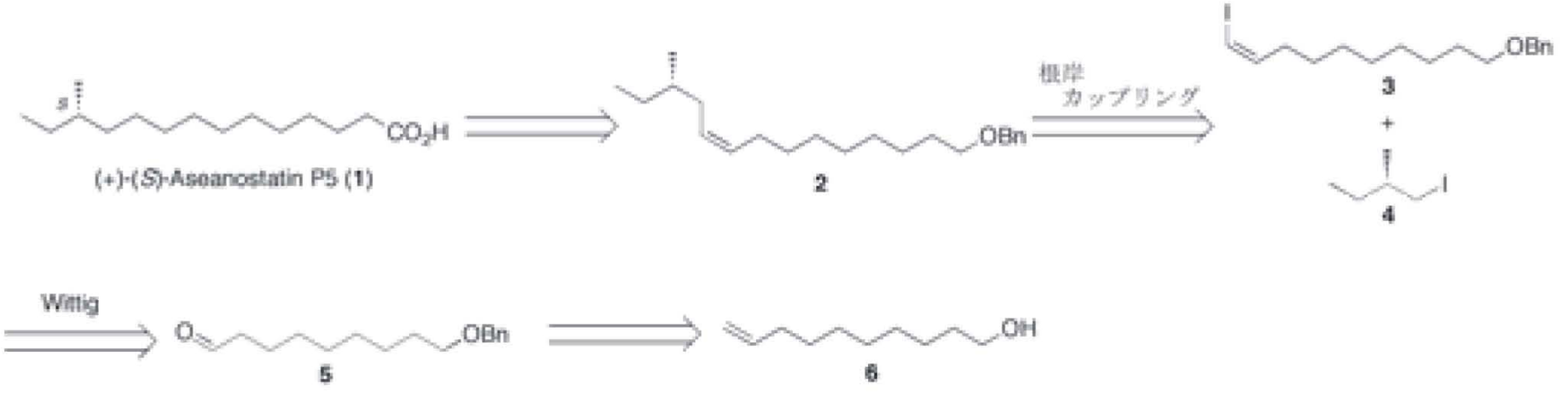
30pmA-434

フタロシン経路阻害剤 Aseanostatin P5 の全合成と構造活性相関研究

○杉田　悠貴[1], 廣瀬　友靖[1,2], 風間　祥文[1], 山地　賢三郎[1,2], 松井　秀仁[2], 中野　洋文[1,2], 花木　秀明[2], 大村　智[2], 砂塚　敏明[1,2]（[1]北里大院感染制御, [2]北里大生命研）

【背景・目的】2008 年にピロリ菌などの病原菌が利用するメナキノン(ビタミン K_2)新規生合成経路である“フタロシン経路”が発見され、その阻害物質として Aseanostatin P5(1)が見出された。本研究では Aseanostatin P5 の生物活性評価への供給と各種誘導体の合成を目的に Aseanostatin P5 の簡便かつ効率的な新規合成ルートの確立に着手した。

【方法・目的】Aseanostatin P5(1)は **2** より還元及び酸化をすることで合成できるものとし、**2** は **3** と光学活性なヨウ素試薬との根岸カップリングを行うことで導けるものとした。**3** は **5** からの Wittig 反応により合成できるものとし、**5** は市販品である **6** から水酸基の保護及びオゾン分解により導けるものとした。

本合成経路により(+)-及び(±)-1 とその誘導体を 6 種合成し抗ピロリ菌活性試験を行った結果(+)-1 を上回る活性を示す誘導体が得られたのでその詳細を報告する。