

29Q-am03

抗ピロリ菌化合物 VDP1 の効率合成

○鰐淵 清史¹, 酒井 佑宜¹, 下村 裕史², 高橋 孝志¹ (¹横浜薬大, ²自治医大)

[目的] *Helicobacter pylori* は消化性潰瘍や胃癌などと密接な関係のあり積極的な除菌が望まれている。*H. pylori* は細胞膜構成脂質中のホスファチジルエタノールアミンを介して、種々のステロイド化合物をその細胞膜に取り込み、自身の膜構成脂質として利用する非常にユニークな性質を持つ。これまでに我々は本菌のステロイド取り込み機能を障害する化合物を探索し、他の一般細菌には作用せず、*H. pylori* へのみ選択的作用する化合物 VDP1 を発見した¹⁾。本発表では、この化合物の動物試験等を視野に入れた効率的な生産法を検討したため報告する。

[方法] VDP1 は VitaminD₃ 酸化切断により調製可能であるが VitaminD₃ の不安定さも相まって非常に物性の類似した化合物群が同時に生み出され、精製が煩雑となる。VitaminD₃ が持つトリエン構造に着目し A 環を固定することができれば効率的に VDP1 を調製できると考え 4-Phenyl-1,2,4-triazoline-3,5-dione を用いた aza-Diels-Alder reaction²⁾を試みた。

[結果・考察] VitaminD₃ に対し 4-Phenyl-1,2,4-triazoline-3,5-dione を室温、遮光化反応させた結果、98%収率で目的物の生産を確認でき、酸化分解後、シリカゲルカラムを通すことで VDP1 のみを効率的に精製回収することに成功した。

[参考文献]

1) Wanibuchi & co-workers, *Scientific Reports*, 5, 8860 (2015)

2) Stefan Werner *et al.*, *Organic Letters*, 5, 3293 (2003)

