

研究区分	教員特別研究推進 地域振興
------	---------------

研究テーマ	フェアリー化合物を基盤とする新規誘導体の合成研究				
研究組織	代表者	所属・職名	薬学部・助教	氏名	大内 仁志
	研究分担者	所属・職名		氏名	
		所属・職名		氏名	
		所属・職名		氏名	
	発表者	所属・職名	薬学部・助教	氏名	大内 仁志

講演題目

フェアリー化合物を基盤とする新規誘導体の合成研究

研究の目的、成果及び今後の展望

芝などが輪状に周囲より繁茂あるいは生育抑制され、後にキノコが発生する現象は古くから「フェアリーリング」という名で知られ、西洋の伝説では妖精が輪を作りその中で踊ると伝えられていた。近年になって静岡大学の河岸らは、キノコからこの現象を惹起する 2 つの化合物 ICA (**1**: imidazole-4-carboxamide) と AHX (**2**: 2-azahypoxanthine) を見出し、その後 **2** の代謝産物である AOH (**3**: 2-aza-8-oxohypoxanthine) を植物中に発見した。フェアリー化合物 (FCs) と名付けられたこれらの化合物は農作物の収量を大幅に増加させることが判明しており、その詳細な分子機構の解明研究の結果、植物に対し様々なストレス (高温・低温・塩・乾燥など) への耐性を与えることが明らかとなっている。申請者は FCs の生合成代謝経路を明らかにするため、様々な FCs の誘導体を合成してきたが、その過程で植物の生長促進以外に興味深い生物活性を持った FCs 誘導体を見出した。そこでこの FCs 誘導体の生物活性向上や物性の改善を目的に、各種アルキル基の導入を中心とした構造変換を行うべく合成研究を行った。

1-3 を基盤とする FCs 誘導体は多数の窒素原子を有しており、ハロゲン化アルキルを用いた通常のアシル化条件では複数の異性体の混合物となってしまう、さらにはその置換位置の決定も困難である。そこで AHX (**2**) のリボシル化体を原料に、アミドのカルボニル酸素とアルキルアミンを置換する手法を用いて位置選択的にアルキル基の導入を行った。この反応ではクロロリン酸ジフェニルとジメチルアミノピリジンを作用させた後にアルキルアミンを加えることで、カルボニル酸素原子の位置に任意のアルキルアミンが導入できるため、単一の化合物を得ることが可能である。本手法を用いることで数種類の誘導体を得ることに成功したため、今後これらの活性を評価していく予定である。

また、得られた誘導体は全てリボシル化体であるため、脱リボシル化した化合物についても合成し、リボシル化体との比較を行いたいと考えている。また今後は **2** 以外の FCs の誘導体に対する位置選択的なアルキル基の導入や、イミダゾール環上の炭素原子への置換基導入についても反応条件を確立し、より高活性な誘導体を見出していくことを計画している。

