

## 生物活性物質としてのアミノ基とシリル基を有する 1,3-ジエン類の活性評価における置換基効果

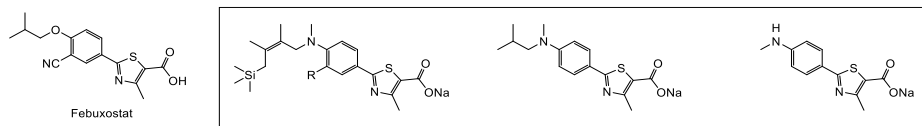
(関西大化学生命工<sup>1</sup>・東京薬大薬<sup>2</sup>) ○西 美沙紀<sup>1</sup>・大日方 基就<sup>1</sup>・山口 歩<sup>1</sup>・青山 洋史<sup>2</sup>・大洞 康嗣<sup>1</sup>

Substituent Effect of Biologically Active 1,3-Dienes Containing Amino and Silyl Groups (<sup>1</sup>Kansai University, Department of Chemistry and Materials Engineering Faculty of Chemistry, Materials and Bioengineering, <sup>2</sup>School of Pharmacy, Tokyo University of Pharmacy & Life Sciences) ○Misaki Nishi,<sup>1</sup> Motonari Obinata,<sup>1</sup> Ayumi Yamaguchi,<sup>1</sup> Hiroshi Aoyama,<sup>2</sup> Yasushi Obora<sup>1</sup>

1,3-dienes are known as useful compounds because complex compounds can be easily synthesized by multifunctionalization<sup>1)</sup>. In our laboratory, we have reported a difunctionalization reaction in which amino and silyl groups are introduced into 1,3-diene in a single step. Additionally, bulky and highly hydrophobic substituents can be introduced by this reaction.<sup>2)</sup> In this study, we focused on the xanthine oxidase inhibitor febuxostat and achieved the synthesis of biologically active compounds of 1,3-dienes having amino and silyl groups. As a result of the evaluation, it was found that this compound shows bioactivity as an inhibitor.<sup>3)</sup> We synthesized analogues of this compound and investigated the effect of substituents on the activity. In this presentation, we will report the synthesis method of the compound and the results of the activity evaluation.

**Keywords :** Xanthine oxidase; Bioactive compounds; Hydrophobic group; Difunctionalization; 1,3-diene

1,3-ジエンは多官能基化することで複雑な化合物を容易に合成できることから有用な原料化合物として知られている<sup>1)</sup>。当研究室ではアミノ基とシリル基を 1,3-ジエンに対して一段階で導入する二官能基化反応を報告した。この手法を用いることにより、1,3-ジエンに疎水性の高い置換基を導入した化合物群の合成が可能となった<sup>2)</sup>。本研究ではキサンチンオキシダーゼ阻害薬であるフェブキシソスタットに着目し、アミノ基とシリル基を有する 1,3-ジエン類の化合物設計と生物活性物質の合成を達成した。得られた化合物を評価した結果、これら化合物は阻害薬としての活性を示すことがわかった<sup>3)</sup>。本講演では化合物の合成法と活性評価の結果について報告するとともにこれら化合物の類似体を合成し、置換基が活性にもたらす影響について検討した。



1) Z. Zhanga, J. Shaoa, C. Fua, L. Xionga, Z. Li, Z. Cui, *Chi. Chem. Lett.*, **2024**, 35, 108794.

2) K. Torii, A. Kawakubo, X. Lin, T. Fujihara, T. Yajima, Y. Obora, *Chem. Eur. J.*, **2021**, 27, 4888.

3) 西美沙紀, 山口歩, 青山洋史, 大洞康嗣, 日本化学会 第 104 春季年会, **2024**, H932-1pm-01.