


広瀬一雄, 北村二郎, 小瀬洋喜, 三島としえ: キノン系化合物の抗菌性作用機序
に関する研究 (第5報)* キノン系化合物の化学構造と抗菌性 (その3)
ベンゾキノン機能誘導体の化学構造と抗菌性**

Kazuo Hirose, Zirō Kitamura, Yōki Ose and Toshie Mishima: Studies on the
Mechanism of Antibacterial Action by Quinones. V Relation between
Antibacterial Properties of Quinones and their Chemical Structures. (III)
On the Functional Derivates of Benzoquinone.

1)* 前報にひきつづきベンゾキノン機能誘導体の抗菌力を試験し, 化学構造との関係を検討した。

キノンのカルボニル基の一ケ又は二ケを $=\text{NH}$, $=\text{NOH}$, $=\text{N}\cdot\text{NH}\cdot\text{CO}\cdot\text{NH}_2$, $=\text{N}\cdot\text{NH}\cdot\text{CS}\cdot\text{NH}_2$ 又は $=\text{N}\cdot\text{NH}\cdot\text{C}(=\text{NH})\text{NH}_2$ 等で置換した機能誘導体については藤川等²⁾及び林³⁾の研究があり何れもそれが有効である事を報告している。之等の機能基はスルファグアニジン, グアノフラシン, チビオン等の中にも有効基として存在して居り, ストレプトマイシンの加水分解によつて生ずるストレプテチジンにも二ケのグアニジン基が存在している事からも作用が期待される。一方スルホンアミド剤の有効性に鑑み A. Novelli 等⁴⁾は β -ヒドロキシナフトキノンのスルホンアミド誘導体 $\text{O}:\text{C}_{10}\text{H}_4:\text{NC}_6\text{H}_4\text{SO}_2\text{NHR}$ の抗菌力を試験したが, これが加水分解をうけて生ずるスルホンアミドの効果だけを認めるだけで該化合物自体の効果を確認することは出来なかつた。筆者等は $=\text{NHSO}_2$  同族体を機能基とする化合物群についてその抗菌性を検討したので報告する。

試験に供した化合物はキノンイミド誘導体 (I) 7種及びそのヒドロキノン体であるアミノフェノール誘導体 (II) 7種の計14種で之等の合成法については別に報告する。被検菌は岐阜衛生研究所保存株の *St. aureus*, *St. albus*, *Sal. typhi*, *Sal. typhi murium*, *Sh. flexneriae* 1b, *E. coli communis*, *E. coli communior* 及び岐阜県立医科大学附属病院保存株の *Trichophyton gypsiium Asteroid* の8株を用いた。

その結果を Table 1 に示す

これ等の化合物は予想に反して無効であり, 殊にアミノフェノール誘導体では殆んど有効性を認める事が出来なかつた。然し乍らキノンイミド類は何れも対応するアミノフェノール類よりも有効で, *Staphylococcus* の発育阻止作用を示すものが多かつた。この事は2位にチオフェノール基を有する化合物はキノンイミド類もアミノフェノール類も共に *Trichophyton gypsiium Asteroid* に対して微小乍ら阻止作用を有したことと共に今後の研究方向を示唆するものと思う。

本研究に対して御鞭撻を賜つた学長宮道悦男博士, 御便宜を賜つた岐阜県立衛生研究所長栗本珍彦博士, 株を御分与賜つた岐阜県立医科大学教授近藤厚博士に心から御礼申し上げる。

* 第三報及び第四報: 昭和30年4月第8回日本薬学大会講演。第二報; 本誌 4, 41 (1954)

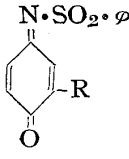

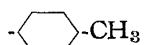

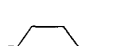
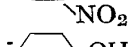
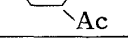
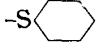

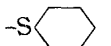
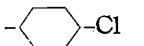
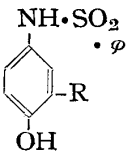

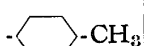

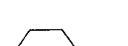
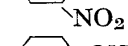
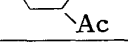
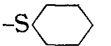

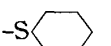
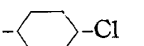
** 昭和30年4月第8回日本薬学大会で要旨講演

1) 赤木, 広瀬, 渡辺, 小瀬; 本誌 4, 35 (1954) 2) 藤川他: 薬誌 73, 20 (1953)

3) 林: 薬学 4, 60 (1950)

4) A. Novelli, et. al.; Rev. soc. arzentina biol., 20., 393 (1944); C.A., 39, 2623 (1945)

Table 1 Antimicrobial Activity of  (I) and  (II)

Structure			microbe								
Nucleous	R	φ	<i>St. aureus</i>	<i>St. albus</i>	<i>Sal. typhi</i>	<i>Sal. typhi murium</i>	<i>Sh. flex. 1b</i>	<i>E. coli commu-nior</i>	<i>E. coli comm-uniis</i>	<i>Tri. gyp. Asteroid</i>	
	H		2	1	—	—	1	—	—	—	
	H		4	2	—	—	1	—	—	—	
	H		1	2	1	—	—	—	—	—	
	H		2	2	—	—	—	—	—	—	
	H		2	2	—	—	1	—	—	—	
											
				1	1	—	—	1	—	—	1
			—	1	—	—	1	—	—	1	
	H		—	—	—	—	—	—	—	—	
	H		—	—	—	—	—	—	—	—	
	H		—	—	—	—	—	—	—	—	
	H		1	1	—	—	1	—	—	—	
	H		—	—	—	—	—	—	—	—	
											
				—	—	—	—	—	—	—	1
			2	4	—	—	1	—	—	1	

—: Non Active M, I, D × 10⁻⁴

実験の部

抗菌試験

1) 既報の方法によつた。

Trichophyton に対する抗菌試験

培養基には 3% ブドウ糖加普通寒天培地を用い、27°C 10 日培養後の発育を肉眼で判定した。