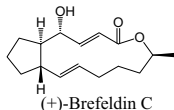
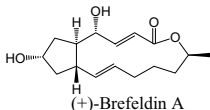


31【P1】I -002

不斉アザクライゼン転位を用いた非天然型及び天然型 Brefeldin C の全合成とその生物活性

○西井 健¹, 向島 真吾¹, 角田 鉄人¹ (徳島文理大薬)

Brefeldin C は、小胞体からゴルジ体へのタンパク質の細胞内輸送を阻害する Brefeldin A の生合成中間体として、野副らによって *Eupenicillium brefeldianum* より単離された化合物である。Brefeldin A の生物活性については詳細に検討されている一方、Brefeldin C の活性は知られていない。



今回我々は、当研究室で開発したアミドエノラートの不斉アザクライゼン転位を応用し Brefeldin C の両エナンチオマーの全合成を達成したので報告する。まず、アルコール **1** を四段階で **2** に変換した後、転位によって立体選択的にアミド **3** を合成した。主生成物であるアミド **4** から非天然型を、副生成物であるアミド **5** から天然型をそれぞれ合成した。現在、これら合成品の生物活性を検討中である。

