

30【P1】I-007

海産グアニジン系天然物バツセラジンの全合成

○下川 淳¹, 白井 浩史¹, 棚谷 綾¹, 橋本 祐一¹, 長澤 和夫¹(¹東大分生研)

【目的】 Batzelladine 類は HIV ウィルスの gp120 とヒト CD4 との結合を阻害し、HIV 治療薬のリードとなる可能性を持っているが、その活性発現機構については報告がない。今回我々はその作用機序を明らかにすることを目的とし、batzelladine A (**1**)の全合成研究を検討した。

【結果】 文献既知のニトロン **2** と **3** の 1,3-双極子付加環化反応後、グアニジノ化、光延反応による環化を施して得られる **4** に対し、TPAP-NMO を用いて酸化することにより α,β -不飽和アルデヒド **5** を得た。続くアルデヒドの酸化、**7** とのエステル化により **1** の 2 環性グアニジン部を合成した。ついで **8** とカップリング後閉環反応を行い **1** の右側 3 環性グアニジン骨格を構築し、最後に脱保護を行うことにより **1** の全合成を達成した。Batzelladine 類の活性発現機構に関する知見も得られたのであわせて報告する。

