

29【B】1530

4-チオフラノイドグリカルを糖供与体として利用するグリコシル化反応:4'-チオヌクレオシドの立体選択的合成

4-Thiofuranoid Glycal-Based Glycosidation: Stereoselective Synthesis of 4'-Thionucleosides

○原口 一広¹(¹昭和大薬)

チミジンや2'-デオキシシチジンのフラノース環の酸素原子がイオウ原子で置き換わった**1**や**2**が抗ウイルス活性や抗腫瘍活性を示すことが報告されて以来、4'-チオヌクレオシドの化学合成に注目が集まっている。従来、4'-チオヌクレオシドはアノマー位に脱離基を有する4-チオ糖と核酸塩基とのグリコシル化により合成されていたが、この方法ではβ-アノマーを立体選択的に得ることは困難であった。

我々は、4-チオフラノイドグリカル(**3**)を糖供与体として利用する核酸塩基との親電子的なグリコシル化により、高いβ-選択性で4'-チオヌクレオシド(**4**)を合成することに初めて成功した。得られた**4**は2'-デオキシ体(**5**)やリボフラノシル体(**6**)へ変換することができた。更に、本合成法は分岐糖誘導体の立体選択的な合成をも可能にした。本発表では、これら最近の研究成果を中心に講演する。

