

アザ-C-ヌクレオシド類の合成研究

大内 秀一¹, 吉田 温子¹, 高畑 廣紀¹, 加藤 敦², 足立 伊佐雄²(¹東北薬大,
²富山医薬大病院薬)

【目的】核酸の糖骨格部分の酸素原子が窒素原子で置き換わり、塩基部分がピリジンやピリミジン等の複素環に置き換わった新規なアザ-C-ヌクレオシド類の合成を検討した。

【実験・結果】合成容易なキラル素子 **1** に NCS, 次いで LiTMP を反応させてイミン **2** とした。イミン **2** にリチウム試薬を反応させて **3** とし、**3** を脱保護することで azapseudouridine を含むアザ-C-ヌクレオシド類を低収率ながら得ることができた。次に、収率の改善を目指して、不安定なイミン **2** を経由しない方法を検討した。キラル素子 **1** に SeO_2 と $30\% \text{H}_2\text{O}_2$ を反応させ、ニトロン **5** とした。ニトロン **5** にグリニヤード試薬を反応させたところ、収率が向上した。現在、この結果を元に種々のアザ-C-ヌクレオシド類の合成を行っている。

