

5-Hydroxymethyl-3-piperidene を経由する1-アザ糖類の立体選択的合成研究

大内 秀一¹, 三原 由起子¹, 小嶋 英知¹, 高畠 廣紀¹(¹東北薬大)

【目的】我々は、前年会において β -グリコシダーゼに対して強い阻害活性を有する1-アザ糖のイソファゴミンおよびその全立体異性体3種の合成を報告した。今回、より立体選択的な合成を達成するため *N*-Boc-5-hydroxymethyl-3-piperidene のオレフィン部の立体選択的ジヒドロキシリ化反応を詳細に検討した。

【実験・結果】光学活性な *N*-Boc-5-hydroxymethyl-3-piperidene **1** に NMO 存在下、触媒量の OsO₄ を反応させた後、脱保護を行なうと *3-epi*-isofagomine が 75%、*4-epi*-isofagomine が 14% の收率で得られた。次に、**1** に 1 当量の TMEDA-OsO₄ 錯体を反応させると *4-epi*-isofagomine の生成比が僅かに向上した。また、**1** のオレフィン部を環状スルフェートとし、PhCO₂H と Cs₂CO₃ を反応させた後、加水分解を行い、isofagomine および *3,4-di-epi*-isofagomine を得た。現在、より立体選択的なジヒドロキシリ化の条件について検討を進めている。

