

# 31-0010

キラルな cAMP-特異的ホスホジエステラーゼ阻害剤の実用的合成

○長尾 善光<sup>1</sup>, Dang Tinh Van<sup>1</sup>, 宮本 素行<sup>1</sup>, 佐野 茂樹<sup>1</sup> (<sup>1</sup>徳島大院薬)

【目的】 M. Van Der Mey らによって開発された抗炎症剤は、cAMP-特異的ホスホジエステラーゼを阻害する。そのキラルな阻害剤の実用的合成を 4(*S*)-isopropyl-1,3-thiazolidine-2-thione [4(*S*)-IPTT] を用いた光学分割によって達成した。

【方法・結果】 *rac*-**1** を PhMgBr と反応させて *rac*-**2** に誘導し、4(*S*)-IPTT との脱水縮合によって得た黄色のジアステレオ異性体混合物をシリカゲルクロマト分離に付して (+)-**3a** 及び (+)-**3b** を得た。両化合物をヒドラジン水和物と加熱下に反応させて、一挙に目的の (-)-**4a** 及び (+)-**4b** の合成を達成した。

