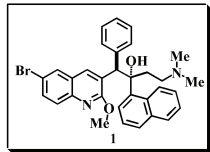
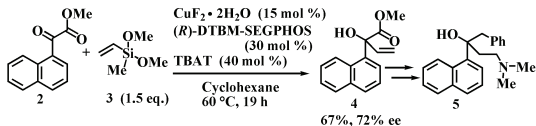


30P1-am326

フッ化銅触媒による不斉ビニル化反応を用いた抗結核剤R207910の合成研究
○横野 早恵¹, Rolf Roesmann¹, 福田 展久¹, 和田 麗子¹, 金井 求¹,
柴崎 正勝¹(¹東大院薬)

【目的】抗結核剤 R207910 (1) は、ジョンソン & ジョンソン社によって開発された新規抗結核剤である。既知の抗結核薬とは異なり、ユニークでかつ強力な ATP 合成経路への阻害機能を示す。¹ 1 は二つの不斉炭素を有するが、従来はラセミ体をキラル液体クロマトグラフィーで分割する手法で合成されている。我々は 1 の立体選択的な効率のよい合成ルートの確立を目指し、当研究室で開発された銅触媒を用いた各種不斉反応を利用した合成研究に着手した。

【実験・結果】 R207910 が有する不斉 4 置換炭素を構築する方法として、当研究室で開発した触媒的不斉ビニル化反応を選択した。² 基質としてケトエステル 2 を用い、反応条件を詳細に検討した結果、生成物 4 が 67% 収率、72% ee で得られた。また、ラセミ体による合成経路の確立を行い、現在 8 工程、44% 収率で中間体 5 を得ている。今後、触媒的不斉反応の最適条件を検討しつつ、5 のさらなる構造変換を行い、1 の合成を達成する予定である。



1) K. Andries *et al.* *Science*, **2005**, 307, 223-227.

2) Tomita, D; Wada, R; Kanai, M; Shibasaki, M. *J. Am. Chem. Soc.* **2005**, 127, 4138-4139.