

26PE-am145

新規4位置換14-エピプレビタミンD₃の合成

○佃 勇也¹, 澤田 大介¹, 高木 健一郎², 石塚 誠一², 橘高 敦史¹ (1帝京大薬, 2帝国人ファーマ創薬2研)

【目的】活性型ビタミン D₃ は常温でプレビタミン型と 94:6 の平衡混合物として存在する。しかし 14 位のエピ化は、存在比が逆転した混合物を与える。我々は 14-エピプレビタミン D₃ においても 2α 置換基を導入すると生物活性に大きな影響を与えることを見出した。今回は 4 位に置換基を導入し、その影響を調べる。

【方法】結晶性エポキシド (1) を LiAlH₄ で還元後、当研究室で開発した方法によりアルデヒド (3) とした。次いでエンイン体 (4) へと導いた後、ヒドロキシメチル化、ヨウ素化しヘック反応で閉環した。(6) をホスフィンオキド (7) へと導き、CD環部 (8) とロシュ法によりカップリング、脱保護、精製して目的化合物を得た。

