

27G-pm14

L-スレオニンアルドラーゼを利用したアザジキトキソース誘導体の合成

○西山 敏弘¹, 梶本 哲也¹, 野出 學¹(¹京都薬大)

【目的】強心配糖体であるジキトキシンの新機能の開発を目指し 5-デオキシ-5-イミノ-D-ジキトキソース(**8**)の誘導体の合成を目的とした。

【実験・結果】D-リボースから容易に調製できるアルデヒド **2** とグリシンとを *C. humicola* (AKU4586) 由来の L-threonine aldolase (LTA)を用いて縮合し、β-ヒドロキシ-α-L-アミノ酸 **3** を得た。アミノ酸のアミノ基を Cbz 基で保護をした後、カルボキシル基をメチル化して **4** に誘導した。メチルエステル部位を還元してできたアルコールをトシル化し *N,O*-アセトナイド保護することによって **5** を得、一級トシレート還元後、脱アセトナイド化、アセチル化、Pd(0)によるアリルアセテートの還元的脱離によって **6** に変換した。**6** の末端オレフィンをおゾン分解することによって **8** の保護体 **7** の合成に成功した。

