

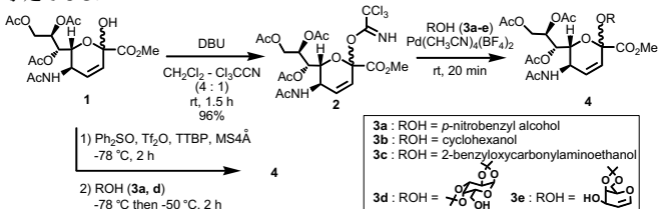
27G-pm16

Ferrier 反応を利用した新規 3,4-不飽和シアル酸誘導体の効率的な合成

○大場 舞¹, 池田 潔¹, 佐藤 雅之¹(¹静岡県大薬)

【目的】ザナミビルは 2,3-不飽和シアル酸誘導体であることから, 3,4-不飽和シアル酸誘導体の抗ウイルス活性に興味を持たれる.¹⁾ 我々は Ferrier グリコシル化反応を利用した新規 3,4-不飽和シアル酸誘導体の合成を検討した.

【方法・結果】Neu5Ac1Me から 3 工程 (60%) で 2-ヒドロキシ体 **1** を合成し, 次いで CCl_3CN との反応により高収率で 2-イミダート体 **2** を得た. **2** とアルコール体 **3a-e** との反応は Pd 触媒 (5-20 mol%) 存在下短時間で完了し **4a-e** (29-51%) を与えた. また, TTBP (2,4,6-tri-*tert*-butylpyrimidine) 存在下 **1** を $\text{Ph}_2\text{SO}/\text{Tf}_2\text{O}$ ²⁾ との反応により 2-シアリルオキソスルホニウム体とし, 続けて系内にアルコール体 **3a, d** を加えることで one-pot で簡便に **4a, d** (30-42%) を得ることができた. 今後, 本反応の適用範囲の拡大と脱保護体の抗インフルエンザウイルス活性を検討する予定である.



1) Ikeda, K. *et al.*, *Synlett*, **2008**, 1027. 2) Crich, D. *et al.*, *Org. Lett.*, **2006**, 8, 959.