

26H-pm01

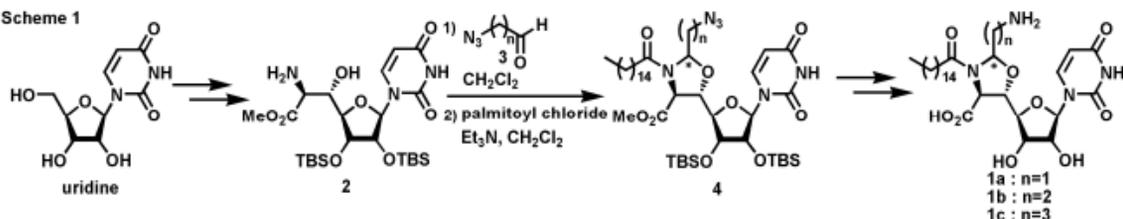
抗菌天然物 FR-900493 のアミノリボース部単純化アナログの合成研究

○伊井 謙介¹, 市川 聡¹, 松田 彰¹(¹北大院薬)

【目的】FR-900493 (Figure 1) に代表されるヌクレオシド系天然物は、新規作用機序を有する抗菌剤のリードとして注目されている¹⁾。我々はFR-900493 をさらに単純化することで、より drug-like な化合物を見出すことを目的として、アミノリボース部の構造をオキサゾリジン環とアミノアルキル基で置換した化合物 **1a-c** を設計した。

【方法・結果】ウリジンから出発して 7 工程でアミノアルコール体 **2** を合成した。**2** とアジドアルデヒド体 **3** を用いて鍵反応である *O,N*-アセタール化反応と、それに続くアシル化反応を行い化合物 **4** を得た。さらに各種官能基変換、保護基の除去を経て、目標の化合物 **1a-c** を合成した (Scheme 1)。現在これらの化合物の抗菌活性を評価中である。

Scheme 1



1) (a) Ochi, K. *et al.*, EP-333177, 1989.; (b) Hirano, S. *et al.*, *Tetrahedron*, 2007, 63, 2798.

