

27P-am159

環状デプシペプチド Callipeltin B の固相全合成研究

○今野 博行¹, 野坂 和人¹, 赤路 健一¹(¹京都府立医大院医)

【目的】 Callipeltin A は海綿 *Callipelta* sp. から得られた抗 HIV 活性を有する環状デプシペプチドである。我々は HIV 阻害剤創製を目指したリード化合物として Callipeltin A の合成法の開発を検討している。今回、その一環として β -MeOTyr の立体化学の決定、含有する異常アミノ酸類の合成ならびに N 末端側ペプチドが脱離した Callipeltin B の固相全合成を検討した。

【方法・結果】 単離時に立体化学が未決定であった β -MeOTyr について、それを含むトリペプチドを合成し、天然物との比較からその立体化学を 2R,3R と決定した。また、DiMepyroGlu ならびに D-alloThr をセリン誘導體より調製した。各アミノ酸の縮合は固相上で C-末端側より順に行った。その後、環化、脱保護反応を行い、Callipeltin B へ導くことができた。その詳細について報告する。

