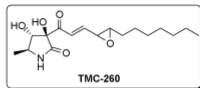


31P-0001

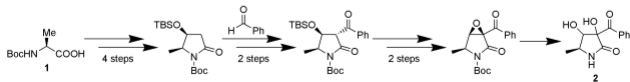
新規 IL-4 シグナル伝達阻害剤 TMC-260 の全合成研究

○丸尾 紗也子¹, 倉持 幸司¹, 椿 一典¹(¹京府大院生命環境)

【背景】不完全菌類の一種である *Acremonium kiliense* Grütz TC 1703 が、IL-4 シグナル伝達阻害剤 TMC-260 を産生することが最近分かった¹。TMC-260 は、高度に官能基化された 5 員環ラクタムの側鎖にアリルエポキシドをもつ興味深い骨格をしているが、その絶対立体化学は決定されておらず、また全合成も達成されていない。そこで本研究では、TMC-260 の効率的な全合成法の確立とともに、その立体化学の決定を目指した。



【進捗状況・最終着地点】類似の骨格を合成する方法は 2 例のみ報告されているが、いずれも工程数が多い。一方我々は現在までに、ベンズアルデヒドを側鎖として組み込んだ基本骨格(2)を、Boc-L-Ala(1)よりわずかに 9 段階で合成することに成功した。しかし、基本骨格の合成には至ったものの、未だその立体化学の決定はできておらず、また、立体選択性や収率向上のために更なる条件検討が必要な段階もある。したがって、今後はこれらの課題や、より効率的な合成ルートの検討にも取り組みつつ、本基質の側鎖およ



び TMC-260 そのものの合成に向けて研究を展開する。

1) Sakurai, M.; Hoshino, H.; Kohno, J.; Nishio, M.; Kishi, N.; Okuda, T.; Kawano, K.; Ohnuki, T.,