

29E09-am02S

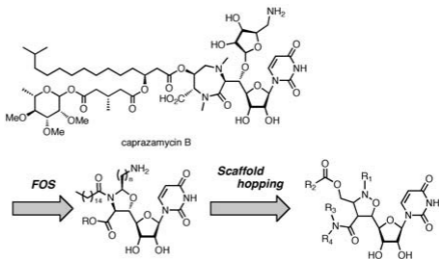
抗菌剤開発を指向したイソキサゾリジン環を有するウリジン誘導体の設計・合成
○山口 繭美¹, 市川 聡¹, 松田 彰¹(¹北大院薬)

【目的】 caprazamycin B は耐性株を含む結核菌および非結核性好酸菌に対し、抗菌活性を有するヌクレオシド系抗生物質である。(MIC = 3.13~12.5 μg/mL)

当研究室では、caprazamycin 類をリード化合物とし、FOS(function-oriented synthesis)¹⁾の概念に基づいて caprazamycin 類の分子構造の簡略化を行ってきた²⁾。今回、更なる包括的な構造活性相関研究を目指して、イソキサゾリジン環を有する分子の設計・合成を検討した。

【方法・結果】

α,β-不飽和エステルを持つウリジン誘導体から、分子内 [3+2] 付加環化反応を行う事によりイソキサゾリジン環を構築した。ラク톤の開環、脂溶性側鎖の導入を経て、目的化合物の合成を行った。



1) Wender, P. *et al.*, *Acc. Chem. Res.*, **2008**, *41*, 40-49.

2) Ii, K. *et al.*, *J. Med. Chem.*, **2010**, *53*, 3793-3813.