30pmA-451

ビニルアゾキシ基を有する殺線虫活性物質 Jietacin A の全合成

○角田　紀明[1], 菅原　章公[1,2], 廣瀬　友靖[1,2], 大村　智[2], 砂塚　敏明[1,2]（[1]北里大院感染制御, [2]北里大生命研）

【背景・目的】　Jietacin A (**1**)は土壌放線菌 *Streptomyces* sp. KP-197 より単離された特異なビニルアゾキシ基を有する抗生物質であり、マツノザイセンチュウに対し強い殺線虫活性を有し、またマウスの腹腔内投与で低毒性であることが明らかになっている。しかし、本化合物は微生物培養液からの量的供給が困難であり、いまだ詳細な活性評価が行えていない。そこで著者らは Jietacin 類の量的供給が可能な全合成ルートの確立を目的とし研究に着手した。

【方法・結果】　逆合成解析として Jietacin A (**1**)の側鎖は別途調製した Grignard 試薬 (**2**)との C-アシルによって構築することとし、特異な構造であるビニルアゾキシ基はアゾ体 (**4**)からの一級水酸基を足掛かりとした位置選択的酸化アゾキシ化、及び水酸基の脱離よるビニル基を構築できると考えた。アゾ体 (**4**)はジカルボニル体 (**5**)とヒドラジノエタノール (**6**)との還元的ヒドラジン化から構築することとした。逆合成解析に則り合成を行った結果、これまでに報告された全合成法よりも短い 7 工程で Jietacin A の全合成を達成した。本年会ではその詳細について報告する。

