29M-pm01S

Luminamicin の全合成研究 (1)；共役無水マレイン酸含有 14 員環マクロライドの合成法の確立

○高田　拓和[1], 菅原　章公[1,2], 廣瀬　友靖[1,2], 君嶋　葵[1], 松丸　尊紀[1,2], 戸田　正輝[1], 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】 北里研究所において単離された Luminamicin (**1**)は、選択的抗嫌気性菌活性を示す天然物であり、偽膜性大腸炎などの嫌気性菌が起因となる疾患の新規抗菌薬として期待される。このことから、その全合成と構造活性相関の解明が創薬展開につながるものと考え、本研究に着手した。

【方法・結果】 複雑な構造を有する **1** の合成達成のため、収束的な経路を立案した。すなわち、中央部のラクトン部分と三置換オレフィンで **1** を切断することで、上部を Northern part (**2**), 下部を Southern part (**3**)と設定し、それぞれの骨格の構築を目指した。今回、我々は Pd 触媒を用いた位置選択的なヒドロスズ化, 効率的な Stille カップリング, そしてフランの酸化の 3 つの鍵反応を用いて Northern part (**2**)の合成を達成し、無水マレイン酸に共役したエノールエーテル部分を有する 14 員環マクロラクトン骨格を合成したので、その詳細を報告する。

