

28AA-am07

Caprazamycin B の触媒的不斉全合成研究

Gopinath PURUSHOTHAMAN¹, Gandamala RAVI¹, 舛田 岳史¹, 渡辺 匠¹,

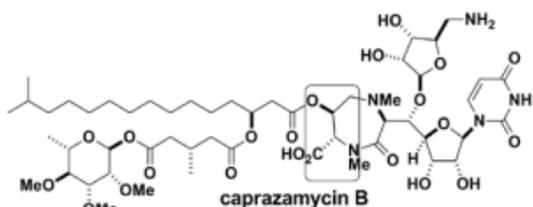
柴崎 正勝¹(¹微化研)

【目的】

caprazamycin B は抗結核活性を有するヌクレオシド系抗生物質であり、超多剤耐性結核菌(XDR-TB) にも効果を示す CPZEN-45 のリード化合物でもある。本研究は新規抗 XDR-TB 剤開発を目指した構造活性相関研究にも適用可能な caprazamycin B の効率的な触媒的不斉全合成法の確立を目的とした。

【結果】

これまでの年会で演者らは本全合成研究に関し、2種の触媒的不斉反応(チオアミドアルドール反応および3-メチルグルタル酸無水物のアルコリスシ)を利用した側鎖部位のエナンチオ選択的合成法、ならびにイソシアノ酢酸エステルとウリジン



由来アルデヒドを基質としたジアステレオ選択的アルドール反応について報告している。今回はジアゼパノン部位の合成を試みた。ここで鍵となるβ-ヒドロキシ-α-アミノ酸構造は(図中囲い部)、所属研究室で開発された*anti*-選択的触媒的不斉ニトロアルドール反応を用いることにより高い立体選択性にて構築することが可能であった(*dr* = 13:1, 95% *ee*)。その後、ジアゼパノン環の形成にも成功しており、現在は側鎖部位の導入とこれに続く脱保護による caprazamycin B の触媒的不斉全合成の完成を目指している。