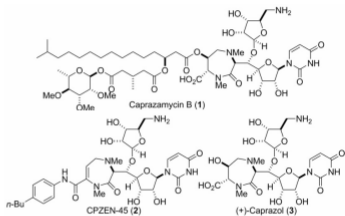


# 27PB-am010

カプラザマイシン類の合成研究：(+)-カプラゾールの触媒的不斉全合成  
Purushothaman GOPINATH<sup>1</sup>, 阿部 光<sup>1</sup>, Lu WANG<sup>1</sup>, Gandamala RAVI<sup>1</sup>, 舛田 岳史<sup>1</sup>,  
○渡辺 匠<sup>1</sup>, 柴崎 正勝<sup>1</sup> (微化研)

【目的】カプラザマイシン B (1) は抗結核活性を有するリポヌクレオシド系抗生物質であり、その半合成誘導体 CPZEN-45 (2) は超多剤耐性結核菌 (XDR-TB) に対しても優れた抗菌活性を示す。本研究はより活性・物性等に優れた抗 XDR-TB 剤の合成的探索の基盤技術となるカプラザマイシン B とカプラゾール (3) の触媒的全合成法確立を目的とする。



【方法】前回の年会までに、主として所属研究室で開発された触媒的不斉反応を用いたカプラゾール前駆体 (アセタールとシリル基を保護基として持つ) とカプラザマイシン B の側鎖部位の立体選択的合成について報告した。引き続き今回は各種構造変換による両化合物の触媒的不斉全合成の完成を目指した。

【結果】上記カプラゾール前駆体はアセトニトリル中フッ化水素酸を作用させ脱保護を行い、カプラゾールの触媒的不斉全合成を達成した<sup>1</sup>。また、カプラゾール骨格と側鎖部位の縮合に成功し、現在カプラザマイシン B の合成に向け検討を重ねている。

1. Gopinath, P., Wang, L., Abe, H., Ravi, G., Masuda, T., Watanabe, T., Shibasaki, M. *Org. Lett.*, **2014**, *16*, 3364-3367.