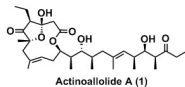


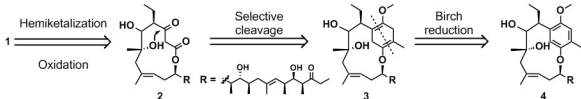
抗トリパノソーマ活性を有する新規天然物 Actinoallolide A の全合成研究

○大下 純¹, 及川 大揮¹, 廣瀬 友靖^{1,2}, 稲橋 佑起^{1,2}, 岩月 正人^{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)

【目的】 Actinoallolide A (1)は北里研究所の大村らによって単離された新規天然物であり¹⁾, アフリカ睡眠病の原因原虫であるトリパノソーマに対して強い活性を示す。本研究では新規アフリカ睡眠病治療薬創製を目標とし、まず 1 を標的とした全合成を行い、その合成経路に則った誘導体合成を行う事で構造活性相関の解明を目指している。



【方法】 1 の構造的特徴として 5 員環ヘミケタールを含む 12 員環マクロラクトンが挙げられる。演者らは該構造を合成最終段階において構築することとし、下に示す合成戦略を立案した。即ち、1 の合成は最終段階において 2 のヘミケタール化および酸化を行うことにより達成することとした。2 は大環状エーテル 4 のベンゼンを Birch 還元によりシクロヘキサジエン 3 とした後、3 置換オレフィン存在下エノール性オレフィンを選択的に酸化開裂させることにより得られると考えた。



【結果】 今回、上記戦略の検討としてシクロヘキサジエン 5 の合成を達成したので報告する。また、現在エノール性オレフィン選択的酸化開裂を検討中である。

1) Ōmura, S. *et.al.* JP2014000229

