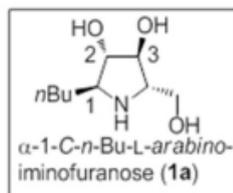


28S-am03S

1-*C-n*-ブチル-L-イミノ糖誘導体の触媒的不斉合成と α -グルコシダーゼ阻害作用に対する構造活性相関

○佐久間 俊嘉¹, 名取 良浩¹, 加藤 敦², 足立 伊佐雄², 中川 進平², 吉村 祐一¹ (¹東北薬大, ²富山大病院薬)

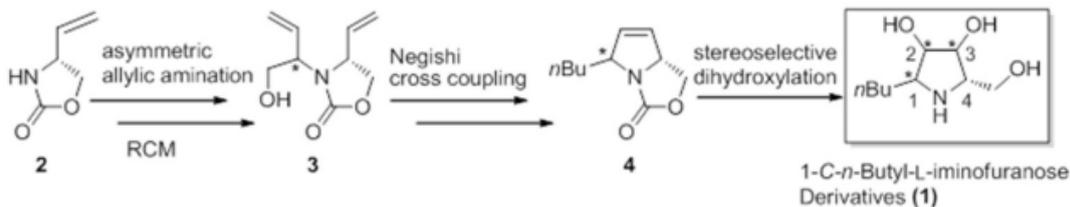
【目的】これまでに我々の研究グループでは α -1-*C-n*-ブチル-L-アラビノイミノ糖誘導体 **1a** が極めて高い α -グルコシダーゼ阻害活性を有することを報告している。¹⁾ そこで我々は、置換基の立体化学が酵素阻害活性に与える影響に興味を持ち、C1位に *n*-ブチル基を持つL-イミノフラノースの全8種の立体異性体(**1**)の構造活性相関研究を行うこととした。



【実験・結果】文献既知の方法²⁾により合成したビニルオキサゾリジノン**2**に対し、不斉アリル位アミノ化、閉環メタセシス反応、根岸クロスカップリングを行い化合物**4**を得た、その後、立体選択的なジヒドロキシル化を経由することで新たな立体異性体の合成を達成した。得られた 1-*C-n*-ブチル-L-イミノフラノース誘導体の α -グルコシダーゼ阻害活性についても報告する。

1) a) *Bioorg. Med. Chem. Lett.* **2011**, *21*, 738. b) *J. Med. Chem.*, **2012**, *55*, 10347.

2) *Chem. Eur. J.* **2006**, *12*, 6607.



Scheme