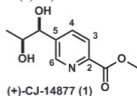


25PA-am003

インターロイキン-1 β 産生阻害活性 CJ-14877 アナログの合成

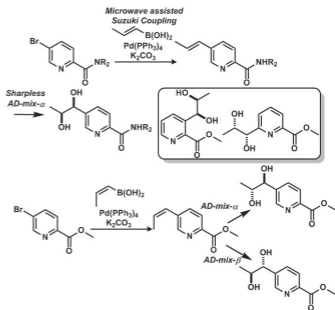
○永田 絵理¹, 大村 友記菜¹, 北沢 望美¹, 安達 禎之², 大野 尚仁², 矢野 玲子¹, 一柳 幸生², 竹谷 孝一², 青柳 裕¹ (金城学院大学,² 東京薬大学)

【目的】昨年開催された136年会において、強力なインターロイキン-1 β 産生阻害活性をもつ *basidiomycete* 由来 CJ-14877 ((+)-**1**) 及びそのエナンチオマー((-)-**1**) を、マイクロ波照射鈴木カップリング反応並びに Sharpless AD 反応を経て効率的に合成したことを報告した。更に、ピリジン環 5 位側鎖の立体配置が活性発現に大きく影響することを見いだした。今回置換基効果を検証する目的で、5 位側鎖における *anti* 立体異性体、ピリジン



環 2 位官能基変換アナログ、5 位側鎖に関するトランスポジションアナログの合成を検討する。

【方法・結果】5-Bromo-2-pycolinic acid を出発原料としアミド化、マイクロ波照射鈴木カップリング反応、Sharpless の AD-mix- α による不斉ジヒドロキシル化反応を順次行い、CJ-14877((+)-**1**) の酸アミドアナログ合成を行った。一方、市販の methyl 3-及び 5-bromo-2-pycolinate を原料として同様の反応を経てトランスポジションアナログ合成を検討している。更に、5 位側鎖における *anti* 異性体アナログの合成を行ったので併せて報告する。



¹ Ichikawa, K. *et al. J. Antibiot.* **2001**, *54*, 703.