

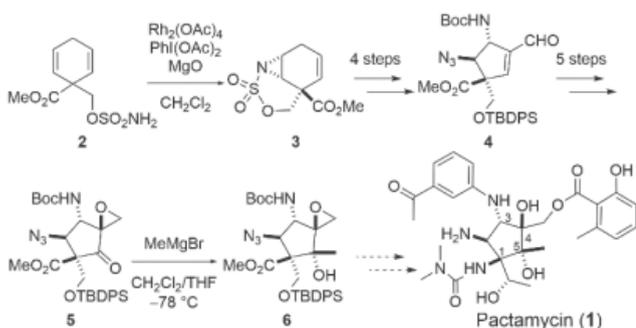
26S-am05S

パクタマイシンの合成研究

○中尾 祐太¹, 近江 弘規¹, 後藤 篤実¹, 吉村 諭¹, 稲井 誠¹, 浅川 倫宏², 江木 正浩³, 菅 敏幸¹ (¹静岡県大薬, ²東海大海洋, ³静岡県大食品栄養)

【目的】 パクタマイシン (**1**) は抗菌活性及び抗腫瘍活性を示すアミノシクロペンチトールである¹⁾。構造的特徴として、シクロペンタン環上の全ての炭素がヘテロ原子により高度に官能基化されていることが挙げられる。我々は生物学的、合成化学的に魅力的な本化合物に興味を持ち、**1** の全合成研究に着手した。

【方法・結果】 容易に調整可能なシクロヘキサジエン **2** に対して「分子内アジリジン化反応による非対称化」を行い、三連続不斉中心を有するアジリジン **3** を合成した。次に、**4** 工程を経てオゾン分解に続く分子内アルドール反応を行い、コア骨格を構築し、**4** を得た。種々官能基変換を行った後 DMDO を用いたエポキシ化を行い **4** 位水酸基を立体選択的に導入し、ケトン **5** へと変換した。さらに、ケトン **5** に対し MeMgBr を作用させ **5** 位含酸素四置換炭素を構築した。今後、種々官能基変換を検討し、**1** の全合成を達成する予定である。



1) Argoudelis, A. D.; Jahnke, H. K.; Fox, J. A. *Antimicrob. Agents Chemother.* **1962**, 191.