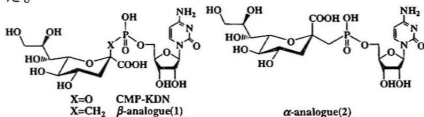


1 A1 30 C-C-P 結合を有する CMP-KDN アナログの立体選択的合成研究

(神奈川大工) 佐藤憲一・石橋 亨・中川貴裕・加藤 実

Study on the Stereoselective Synthesis of CMP-KDN Analogues Having C-C-P Bond
(Faculty of Engineering, Kanagawa University) Sato, Ken-ichi; Ishibashi, Tohru; Nakagawa, Takahiro; Kato, Minoru

1. アノマー位に C-C-P 結合を有する CMP-シアル酸アナログの α 体は CMP-シアル酸輸送タンパクを阻害し、 β 体はシアル酸転移酵素を CMP と同程度阻害する。演者は CMP-KDN 輸送タンパクや KDN 転移酵素も同様な基質認識を示すかに興味を持ち、CMP-KDN アナログ(1, 2)を合成する事とした。本研究では特に同一中間体から β 体(1)、 α 体(2)を効率よく作り分ける手法の開発を目指し検討を行った。



2, 3. アノマー位の立体の異なる 1, 2 を効率的に合成するためには、立体選択的に C-グリコシル化するのが近道と考え検討した結果、 β -選択的な C-シアノグリコシル化反応を見出した。この β -C-グリコシド 4 のシアノ基をホルミル基へと変換し 5 を得、ホスホン酸エステル、シチジンを導入して目的とする β 体 1 を合成することができた。また、4 のエステルを還元してヒドロキシメチル体 6 とし、シアノ基をカルボキシル基へ変換することで 13 を得た。さらにホスホン酸エステル、シチジンの導入を行い、目的とする α 体 2 を合成することができた。

