

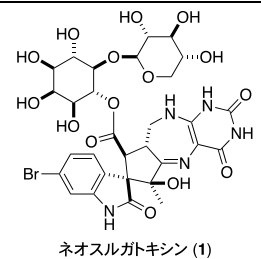
研究区分	教員特別研究推進 独創・先進的研究
------	-------------------

研究テーマ	有機分子触媒を活用したネオスルガトキシンの合成研究				
研究組織	代表者	所属・職名	薬学部・准教授	氏名	稲井 誠
	研究分担者	所属・職名	薬学部・准教授	氏名	吉村 文彦
		所属・職名	薬学部・助教	氏名	大内 仁志
		所属・職名		氏名	
	発表者	所属・職名	薬学部・准教授	氏名	稲井 誠

講演題目	ネオスルガトキシンの合成研究
------	----------------

研究の目的、成果及び今後の展望

含窒素四置換炭素を分子内に有する天然物は、興味深い生物活性を有する化合物が多数報告されており、それらを化学的に合成可能とする高立体選択的な反応の開発や生物活性評価に高い関心が寄せられている。そのような化合物の一つとして、本学の小菅らにより単離構造決定された、静岡県駿河湾産バイ貝由来の食中毒原因物質ネオスルガトキシン (1) がある。現在のところ、1 を毒成分とした食中毒は終息しており、天然資源より化合物を得ることは不可能であるためその合成法の開発に着手した。



ブロモイサチン (2) を出発原料にケトン部を増炭して 3 へと変換した後、鍵となる不斉有機触媒を用いた共役付加反応を検討した。不飽和アルデヒド末端水酸基の保護基、反応温度、溶媒、不斉有機触媒を種々検討したところ、トルエン中、Hayashi-Jorgensen 触媒存在下に 0 °C にて反応させると満足できる収率にて生成物 4 を合成できた。なお、ジアステレオ選択性、光学純度に関しては現在精査中である。得られた 4 を数段階にて 5 へと変換後、ニトリル部分を還元して、環化前駆体となるオキシム 6 へと変換した。6 に対し NaClO を作用させると系中でニトリルオキシド 7 が生成し、1,3-双極子付加環化反応により 8 を合成した。N-O 結合を Raney-Ni により切断し 9 へと変換後、光延反応により窒素原子を導入し 10 へと導いた。現在、10 から 1 への変換を検討中である。

