

ツガシン cmc-A の合成研究 Synthetic studies of Thuggacin cmc-A

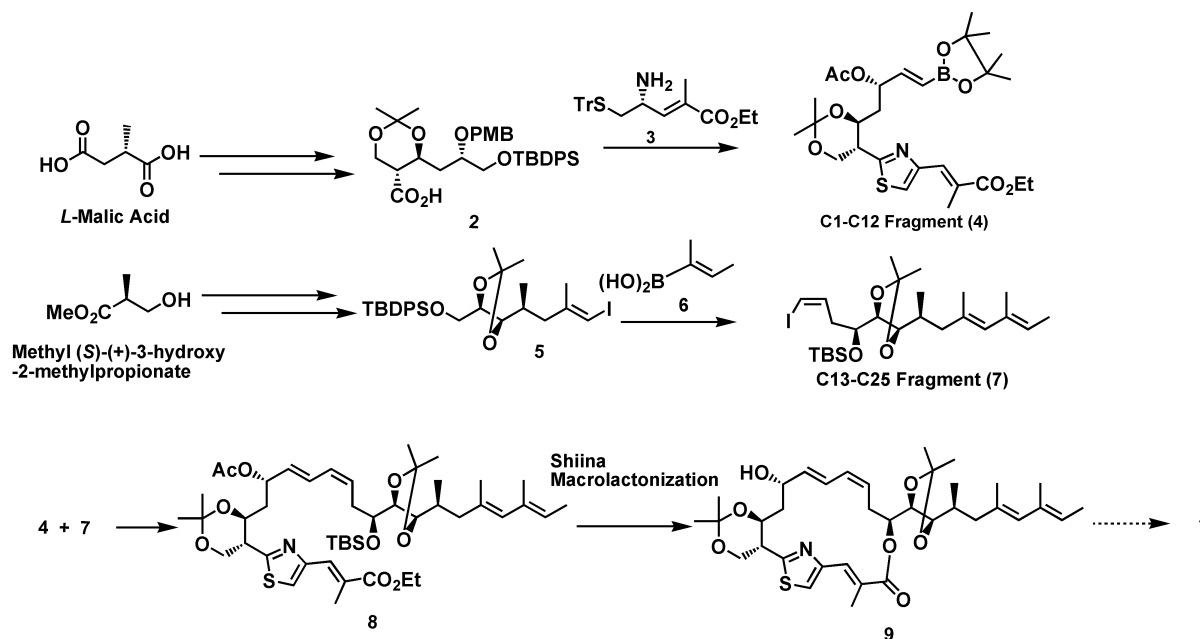
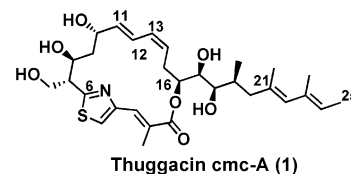
松本 萌¹⁾、岩崎 瞳¹⁾、富澤 慧¹⁾、西丸 達也¹⁾、石原 淳¹⁾、Jacques Eustache²⁾、
畑山 範¹⁾

(1 長崎大学大学院医歯薬学総合研究科薬品製造化学研究室)

(2 オート・アルザス大学ミュールーズ国立高等化学院)

目的: ツガシン cmc-A(1)は多剤耐性を獲得した結核菌に対し強力な呼吸鎖阻害活性を有するマクロリド抗生物質である¹⁾。既に Kirschning ら²⁾や柴崎ら³⁾によりツガシン A 及び B の全合成が達成されているが、本天然物は平面構造が明らかになっているのみで相対及び絶対配置は未決定である。我々は 1 の立体化学がツガシン A~C と同様であると仮定し、立体構造の確認と合成法の確立を目的に 1 の合成に着手した。

結果: L-リンゴ酸から 11 工程で得られるカルボン酸 2 と、L-システイン誘導体 3 とのカップリングを経て C1-C12 フラグメント 4 を合成した。一方、S-ヒドロキシイソ酪酸メチルから 12 工程で得られるビニルヨージド 5 とボロン酸 6 との鈴木-宮浦カップリングを経て、C13-C25 フラグメント 7 を合成した。さらにフラグメント 4 及び 7 を連結して 8 を合成し、マクロラクトン化を経てツガシン cmc-A の保護体 9 の合成に成功した。



<参考文献>

- 1) R. Jansen et. al., *Chem. Eur. J.*, **2007**, *13*, 5822-5832.
- 2) M. Bock, R. Dehn, A. Kirschning, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2008**, *47*, 9134-9137.
- 3) A. Matsuzawa, C. R. Opie¹, N. Kumagai, M. Shibasaki, *Chem. Eur. J.* **2014**, *20*, 68-71

発表者紹介

氏名 松本 萌 (まつもと もえ)
 所属 長崎大学大学院医歯薬学総合研究科
 学年 博士前期 1 年
 研究室 薬品製造化学研究室

