

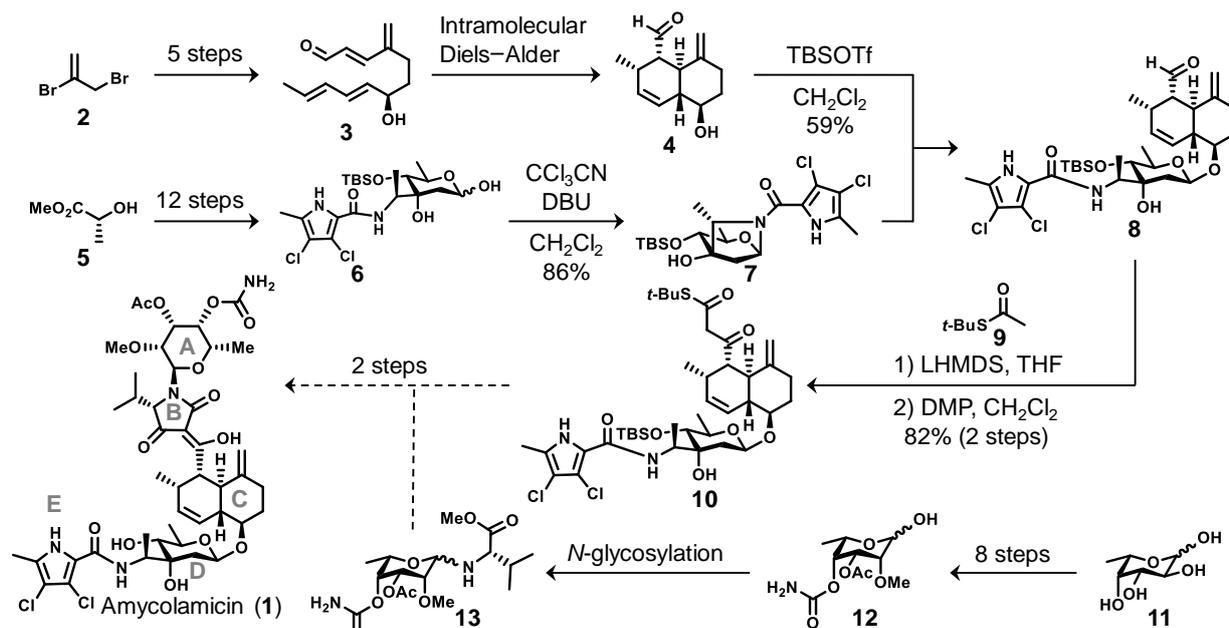


Amycolamicin の全合成研究 Synthetic Study of Amycolamicin

目黒康洋、桑原重文（東北大院農）

Amycolamicin(1)は希少放線菌 *Amycolatopsis* sp. MK575-fF5 および *Kibdelosporangium* sp. MA7395 が生産する抗生物質であり MRSA、VRE を始め極めて広範なグラム陽性・陰性の薬剤耐性菌に対して強力な抗菌作用を示す。1 は 2 つの新規単糖ユニットを含む過去に類例の無いハイブリッド型化学構造を有しており、有機合成化学の見地からも挑戦的な合成標的である。我々は、各種誘導体の合成にも柔軟に対応できる収束的合成経路を開拓して 1 の初の全合成に挑む。本発表では、1 の各ユニットの合成及び連結工程について報告する。

C ユニット 4 の合成は、2 を出発原料として HWE 反応、Heck 反応及び不斉還元を含む 5 工程の変換により 3 へと導いた後、分子内 Diels-Alder 反応によりトランス-デカリン構造を構築することで完了した。DE ユニット 7 は、D-乳酸メチルから四置換不斉中心の構築を含む 12 工程の変換により 6 へと導いた後、N,O-アセタール環を形成することで合成した。得られた 4 と 7 に TBSOTf を作用させることでグリコシル化が進行し、8 を得た。続いて、8 に対して 9 を用いたアルドール反応と Dess-Martin 酸化により 10 へと変換した。A ユニット 13 は L-フコース 11 から保護基の調製と L-バリンメチルエステルとの N-グリコシル化により合成を完了した。現在、Amycolamicin の初の全合成に向けて 10 と 13 の連結及び B ユニットの構築を検討中である。



Scheme 1. Convergent synthesis of amycolamicin.

<参考文献>

1) Meguro, Y.; Ogura, Y.; Enomoto, M.; Kuwahara, S.; *J. Org. Chem.* **2019**, *84*, 7474-7479.

発表者紹介

氏名 目黒 康洋 (めぐろ やすひろ)
所属 東北大学大学院農学研究科
生物産業創成科学専攻
学年 日本学術振興会特別研究員 (PD)
研究室 生物有機化学分野

