

## 第 448 回集談会

1. 日時：2013 年 12 月 16 日（月）16:30～
2. 場所：2A 講義棟（中央棟 2 階）
3. 座長：創薬化学教室 准教授 猪股浩平（内線 3950）
4. 演者：分子薬化学教室 准教授 吉村祐一（内線 3958）
5. 演題：グリコシル化反応の開発を基盤とする新規ヌクレオシド誘導体の合成研究
6. 要旨：ヌクレオシド誘導体は、医薬品化学やバイオ関連分野で幅広く利用されており、新規機能性分子の開発を目的として多くの化合物が合成されている。より多様な誘導体の創製を目的とした場合、天然ヌクレオシドからの誘導には自ずと限界が生じる。そこでしばしば用いられるのが、修飾を施した糖部を合成した後、核酸塩基との間でグリコシル化反応を行い所望のヌクレオシド誘導体を得る方法である。当研究室では、これまでグリコシル化反応の開発を中心とした新規ヌクレオシド誘導体の合成研究を行ってきた。きっかけとなったのが、新規抗腫瘍性 4'-チオヌクレオシドを合成する際、糖部に相当するスルホキシド誘導体と核酸塩基を直接カップリングする Pummerer 型チオグリコシル化反応の開発を行ったことであった。同反応では、スルホキシドへの酸化と連続したルイス酸処理を組み合わせたグリコシル化反応を行っている。このコンセプトを拡張し、超原子価ヨウ素を利用した環状アリルシラン誘導体から炭素環ヌクレオシド誘導体を合成する反応の開発やグリカル誘導体よりジヒドロピラノヌクレオシドを合成する手法の開発に成功した。本講演では、一連の反応開発と新規ヌクレオシド誘導体合成への応用について紹介する。