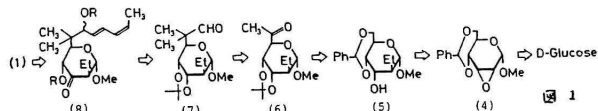
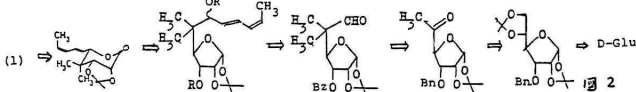


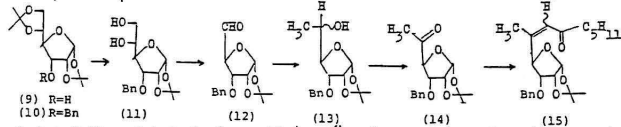
1. *Streptomyces Goldiniensis* より単離構造決定された抗生物質 *Aurodox* は、種々のグラム陽性菌に対し抗菌活性を示し、その全合成は、K. C. Nicolaou によりすでに報告されている¹⁾。ゴルジノラクトン(1)はこれら一連の抗生物質を構成する物質の一つで、そのピラノース環内に4級炭素を含み、また同じ環から炭素鎖がのびた特異な構造を持つ化合物である。従って安価なD-グルコースを原料とする光学的活性な1の合成について検討し知見を得たので報告する。



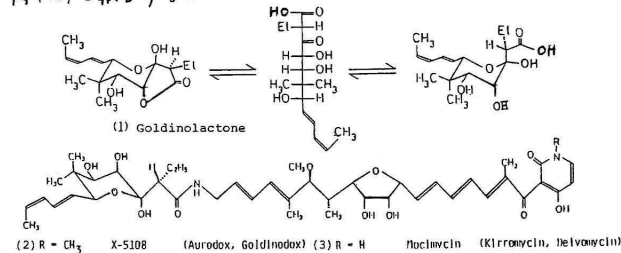
の酸にさらす必要をほらう必要がある。さらにエチル基の導入など大量に原料を供給するのが困難であると判断し、より簡便な別ルートによる合成法を検討した。その逆合成ルートを図2に示した。



D-グルコースより3行程で得られる(9)を常法によりベンジル化し98.4%の収率でベンジル体(10)を得た。これを91%酢酸で部分加水分解し定量的に(11)を得た。これを過ヨウ素酸酸化して「グリニヤール反応を行ない87.5%の収率で相当するC-メチル誘導体(13)を得た。これをスワン酸化し相当するケトン誘導体(14)を96.3%の収率で得た。ついでWittig反応により共役エノン誘導体(15)を51.2%の収率で得た。さらに先の反応について現在検討中である。



1) R. E. Dolle and K. C. Nicolaou, *J. Am. Chem. Soc.* 1985, 107, 1691-1701
2) 5回有機合成化学協会関東支部新潟シンポジウム要旨集, p.15



2.3. 糖類を出発原料として1を立体選択的に合成するために環内炭素の4級化あるいは環外炭素の4級化が考えられるが、ここでは4級化する炭素を環外とし、4級化の方法としては共役エノンに対する1,4付加を利用することとした。はじめに検討した方法の逆合成ルートを示すと図1のようになり、エポキシド(4)を原料として(7)を合成しすでに報告した²⁾。しかしながらこの合成ルートでは2-デオキシ糖を出発原料とするため、酢酸程度

こうけんいち・さのてつ也・やまもりとしお・ながいかつり・かさいやすき・よしむらじゆうじ・はしもとかろのぶ¹⁾