

研究代表者氏名	北 泰 行			研究組織	4 人	
所属機関・部局・職	大阪大学・大学院薬学研究科・教授			所属機関所在地	吹田市	
研究課題名	環境調和型反応に重点を置いた生物活性天然物の大量合成手法の開発と創薬研究					
研究の概要等	<p>申請者らは、優れた生物活性を有するが微量しか得られず、複雑な高次構造を有する天然物の高選択的な大量合成法の開発と分子設計による創薬研究を目標にして、合理的な合成アプローチの立案、そのために必要な種々の新反応や反応剤の開発、その応用による全合成研究を行ってきた。既にこれまでに、本目的に適った方法で、抗腫瘍活性天然物のフレデリカマイシン A の不斉全合成や、新奇な含硫スピロエノン骨格と抗腫瘍活性で注目されているディスコハブデン A の最初の全合成に成功した。一方、申請者らは、20年近く、毒性のある重金属酸化剤に代わる低毒性の超原子価ヨウ素反応剤を用いる反応を研究し、既にカチオンラジカルを生じさせる優れた新活性化法を見出し、数々の新規酸化反応を開発してきた。また最近、生体触媒を利用する新不斉合成反応や、有機化合物のラジカル反応を水中室温下で進行させることにも成功した。</p> <p>本研究では、このように環境調和型反応の開発に重点を置きながら、複雑な構造を有する天然化合物の全合成を行なうと共に、その大量合成手法を確立し、コンピュータ支援の合目的的な創薬研究へ展開することを目的とする。</p>					
当該研究課題と関連の深い論文・著書（研究代表者のみ）	<p>Enantioselective Total Synthesis of a Potent Antitumor Antibiotic, Fredericamycin A, <i>J. Am. Chem. Soc.</i> 2001, <i>123</i>, 3214-3222.</p> <p>Efficient Oxidative Biaryl Coupling Reaction of Phenol Ether Derivatives Using Hypervalent Iodine(III) Reagents, <i>Tetrahedron</i> 2001, <i>57</i>, 345-352.</p> <p>Novel and Efficient Synthesis of <i>p</i>-Quinones in Water via Oxidative Demethylation of Phenol Ethers Using Hypervalent Iodine(III) Reagents, <i>Tetrahedron Lett.</i> 2001, <i>42</i>, 6899-6902.</p> <p>Enantiodivergent Synthesis of Either Enantiomer of ABCDE-Ring Analog of Antitumor Antibiotic, Fredericamycin A via Intramolecular [4+2] Cycloaddition Approach, <i>Org. Lett.</i> 2001, <i>3</i>, 4015-4018.</p> <p>Facile and Efficient Sulfenylation Method Using Quinone Mono <i>O,S</i>-Acetals under Mild Conditions, <i>J. Org. Chem.</i> 2001, <i>66</i>, 2434-2441.</p> <p>A Novel and Efficient Methodology for the C-C Bond Forming Radical Cyclization of Hydrophobic Substrates in Water, <i>Org. Lett.</i> 2001, <i>3</i>, 1157-1160.</p> <p>An Efficient Lipase-Catalyzed Enantioselective Desymmetrization of Prochiral 2,2-Disubstituted 1,3-Propanediols and Meso 1,2-Diols Using 1-Ethoxyvinyl 2-Furoate, <i>J. Org. Chem.</i> 2002, <i>67</i>, 411-419.</p> <p>Synthetic Studies on Sulfur Cross-linked Core of Antitumor Marine Alkaloid, Discorhabdins: Total Synthesis of Discorhabdin A, <i>Angew. Chem. Int. Ed.</i> 2002, <i>41</i>, 348-350.</p>					
研究期間	平成13年度～17年度					
研究経費 (15年度以降は内約額)	平成13年度 千円 19,100	平成14年度 千円 18,100	平成15年度 千円 18,100	平成16年度 千円 18,100	平成17年度 千円 18,100	合計 千円 91,500