

【300】

氏 名 岩 村 俣
いわ むら はじめ

学 位 の 種 類 農 学 博 士

学 位 記 番 号 農 博 第 82 号

学 位 授 与 の 日 付 昭 和 42 年 7 月 24 日

学 位 授 与 の 要 件 学 位 規 則 第 5 条 第 1 項 該 当

研 究 科 ・ 専 攻 農 学 研 究 科 農 芸 化 学 専 攻

学 位 論 文 題 目

SYNTHESIS OF NEBULARINE AND TOYOCA-MYCIN ANALOGS BY FUSION PROCEDURE USING A NEW CATALYST

(新触媒を用いた溶融法によるネブラリンおよびトヨカマイシン関連化合物の合成)

論文調査委員 (主 査) 教 授 三 井 哲 夫 教 授 中 島 稔 教 授 小 野 寺 幸 之 進

論 文 内 容 の 要 旨

ネブラリンやトヨカマイシンなどはヌクレオシド型抗生物質である。ヌクレオシドの合成には種々の方法が試みられているが、本論文の著者は溶融法について研究し、特に種々の新しい触媒について検討した。その結果従来知られていなかった新触媒を見出し、ヌクレオシドを好収量で合成することに成功した。本研究の内容は次の3段階に区分することができる。その1は溶融法における触媒の探索である。本研究では触媒として強い有機酸である bis-(p-nitrophenyl) hydrogen phosphate (以下 BNPP と略記) をはじめ、この類縁化合物を新たにとりあげて、テオフィリンと penta-O-acetyl-β-D-glucopyranose との反応を試み、また同時に従来の代表的触媒類による比較合成を行ない、収量を検討したところ BNPP がいずれよりもすぐれていることを知った。第2はこの BNPP をネブラリンおよびその関連物質の合成に応用する研究であり、プリンと tetra-O-acetyl-D-ribofuranose の縮合反応を試みたところ、2種の物質を同時に生成することを認めた。この両者は構造研究の結果ネブラリンとその位置異性体である N-β-D-ribofuranosyl purine とであることが明らかになり、後者をイソネブラリンと名づけた。さらに本法によって7種のヌクレオシドの合成に成功した。本研究の第3段階として、本方法の適用範囲の拡大を目的として 7-デアザプリン類特にトヨカマイシン類縁物質の合成を試みた。その結果 4-amino-5-cyano-6-methylmercaptopyrrolo [2,3-d] pyrimidine のジアセテートと tetra-O-acetyl-D-ribofuranose とを BNPP と共に溶融して、目的とするリボフラノシドを好収量で得た。

論 文 審 査 の 結 果 の 要 旨

ヌクレオシドは動植物界に広く分布し、生体内の種々の物質代謝経路に関与し、さらに核酸の構成成分であることから、生化学的に非常に重要な化合物である。従来このヌクレオシドの合成は数多く試みられてきているが近年溶融法が特に注目されている。溶融法においては有効な触媒を見つけることが最も重要であり、今までにも多種類の有機および無機酸類についての試験結果が報告されている。本論文の著者が

この研究によって見つけた bis-(p-nitrophenyl) hydrogen phosphate (BNPP) は新触媒であり、従来のものに比して合成反応の収率を著しく良好にすることが明らかとなった。またこれを用いて行なった合成研究のうちプリンと tetra-O-acetyl-D-ribofuranose との反応によって、ネブラリンとイソネブラリンとが同時に生成することが明らかになり、これは溶融法による位置異性体の同時生成の最初の例である。さらにトヨカマイシンは 7-デアザプリン骨格を持つ化合物であり、この種の化合物は合成が成功していなかったものであるが、本論文の著者が本法を適用して、その類縁物の合成に成功したのはすぐれた成果で合成化学に貢献するところが大きい。

よって本論文は農学博士の学位論文として価値あるものと認める。