

\*

분류번호	I-P-24
------	--------

제 목	항 바이러스 작용이 기대되는 Uridine의 2',3'-Seco 유도체의 합성
연 구 자	천문우, 양재욱, 이정원, 송선용
소 속	서울대학교 약학대학
내 용	<p>목적하는 화합물인 2',5'-dihydroxy-3'-무치환 유도체(1)는 uridine을 sodium metaperiodate로 산화하여 dialdehyde를 얻은다음 1,2-dianilinoethane으로 3'-aldehyde만을 선택적으로 보호, 2'-aldehyde를 NaBH<sub>4</sub>로 환원, alcohol로 하여 deprotection 하므로써 hemiacetal을 얻는다. 이 hemiacetal을 TsNHNH<sub>2</sub>로 처리하여 목적하는(1) 화합물을 얻었으며 2-azido-5-Hydroxy-3'-무치환 유도체(2)는 (1)화합물 합성시 얻은 hemiacetal을 출발 물질로 하여 먼저 TBDPSCl로 silylation하여 5'-hydroxyl group을 보호하고 TsNHNH<sub>2</sub>로 3'-위치를 hydrazone으로 한다음 NaB(CN)<sub>3</sub>로 처리하여 얻은 hydrazide를 NaOAc를 반응시켜 2'-hydroxy-3'-무치환-5'-silyl 유도체를 얻고 또한 2',3'-dihydroxy group을 tosyl화, azido화, 5'-silyl group을 deprotection 하므로써 (2)를 얻었다. 또한 2',3'-dihydroxy-5'-무치환 유도체(4)는 uridine의 2',3'-위치를 먼저 protection, 5'-위치를 benzoyl화 2',3'-deprotection, periodate oxidation하여 얻은 diol을 silyl화 한 다음 5'-위치를 benzoyl화, 2',3'-deprotection, 산화하여 얻은 hemiacetal의 silyl group을 제거한후 primary hydroxyl group만을 선택적으로 silyl화, TsNHNH<sub>2</sub>, NaB(CN)<sub>3</sub> 및 NaOAc로 처리 하므로써 얻은 2'-hydroxy-3'-O-silyl group-5'-무치환 화합물을 tosyl, azido화 한다음 desilylation하여 얻었다. 목적하는(1) 화합물의 diastomer인 2',3'-dihydroxy-5'-무치환 유도체(3)는 (4)화합물 합성시 얻은 hemiacetal을 key intermediate로 하여 TsNHNH<sub>2</sub>, NaB(CN)<sub>3</sub> 및 NaOAc로 처리하므로써 얻을수 있었다. 이들 화합물들의 각종 DNA 및 RNA virus에 대한 항 바이러스 작용을 검토한 결과 현저한 항 바이러스 작용을 나타내지 않았다.</p>