

31【P1】I-006

不斉有機触媒を用いた(+)-Wortmanninの不斉全合成研究

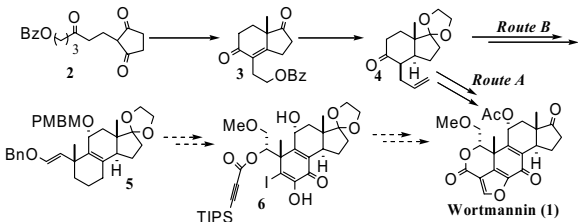
○重久 浩樹¹, 水谷 尊志¹, 本沢 忍¹, 戸崎 慎也¹, 大嶋 孝志¹, 柴崎 正勝¹ (¹東大院薬)

【目的】PI3-Kinase 阻害剤 Wortmannin(**1**)はその生物活性および複雑な構造から合成化学的に注目されている化合物である。当研究室では先に本化合物のラセミ対の全合成を達成したが¹⁾、今回、光学活性体として**1**を得ることを目的として不斉全合成研究に着手した。

【実験・結果】これまでの検討から、フェニルアラニンを触媒とする触媒的不斉分子内アルドール縮合によって**2**から**3**を、高収率かつ高不斉収率で得ることに成功した。次に、我々は閉環体**3**から、先の合成中間体**4**の変換の検討を行い、トランスヒドリンダンのトランス還元を含む、9工程で**4**への変換に成功し、

(+)-Wortmanninの形式不斉全合成を達成した(Route A)。現在、さらなる合成経路の短縮を目的

として、化合物**6**を重要中間体とするパラジウム触媒によるドミノ環化反応の検討を予定している(Route B)。



- (1) Mizutani, T.; Honzawa, S.; Tosaki, S.; Shibasaki, M. *Angew. Chem., Int. Ed.* **2002**, *41*, 4680-4682.