

30【P1】I-004

ヨウ化サマリウムによる還元的脱アミノ化反応を利用した kuraramine 及び cytisine の合成研究

○高橋 理恵¹, 双木 秀紀¹, 本多 利雄¹(¹星薬大)

【目的】Kuraramine 及び cytisine は、特異な骨格を有するジペリジン型ルピンアルカロイドであり、cytisine は神経のニコチン性アセチルコリン受容体に特異的に結合し、部分作動薬として働くことが明らかとなっていることから重要なプローブとされている。今回、ヨウ化サマリウムによる還元的脱アミノ化を鍵反応とする、kuraramine 及び cytisine の簡易合成経路の確立を目的とした。

【方法】入手容易な trans-4-hydroxy-L-proline (1) を原料に用い、数工程を経て化合物 (2) へと変換した後、鍵反応であるヨウ化サマリウムによる還元的脱アミノ化反応を行いアミド (3) を得る。アミド (3) から数工程を経て kuraramine 及び cytisine の全合成を行うことを検討した。

【結果】化合物 (2) に対し、5 当量の 2M ヨウ化サマリウム-THF 溶液及び 2.5 当量のピバリン酸を反応させることにより望む化合物 (3) を得た。次いで N-メチル化、N-ベンジル化をそれぞれ行い、数工程進めることにより天然物である jussiaeiiineA 及び isokuraramine を合成することに成功した。現在、最終目的化合物である kuraramine 及び cytisine の合成を検討中である。

