

【目的】 Kuraramine 及び cytisine は特異な骨格を有するジピペリジン型ルピンアルカロイドであり、cytisine はニコチン性アセチルコリン受容体(nAChRs)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、cytisine を含む 4 化合物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、数工程を経て鍵中間体(2)へと変換した後、SmI₂ による還元的脱アミノ化反応に付しアミド(3)を得た。さらに数工程を経て kuraramine 及び cytisine の全合成を行った。

【結果】 化合物(2)に対し、5 当量の 0.2MSmI₂-THF 溶液及び 2.5 当量の MeOH 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 kuraramine 及び cytisine を含む 4 化合物の全合成に成功した。

