

30P1-am324

カイトセファリンの合成研究

○高橋 圭介¹, 原口 那津美¹, 石原 淳¹, 畑山 範¹ (長崎大院医歯薬)

【目的】AMPA/KA型グルタミン酸受容体アンタゴニストであるカイトセファリンの新規な合成ルートを確認する。

【方法・結果】Sharpless不斉エポキシ化を経て得られるキラルエポキシド**1**をPd(PPh₃)₄を用いる辻-Trost条件に付したところ、4級中心においても2重反転が起こり、光学純度をほぼ維持しつつピロリジン環**2**が得られることを見出した。エポキシベンゾイルカルバメートの環化により右側鎖の窒素原子を位置、立体選択的に導入して**3**とした後、官能基変換を経てニトロン**4**へと導いた。現在までに**4**とヨードアラニン誘導体**5**との北原-渡邊カップリングにより、低収率ながらカイトセファリンの全炭素骨格を有する**6**を得ている。

