

27J-am06

パラジウム触媒を用いたアレンの連続環化反応による Ergot alkaloid 骨格の一举構築

○井貫 晋輔¹, 大石 真也¹, 藤井 信孝¹, 大野 浩章¹ (¹京大院薬)

【目的】 Ergot alkaloid 類はイネ科、カヤツリグサ科植物の穂に寄生するカビの菌核より抽出されたインドールアルカロイドでありドパミン受容体作動作用、セロトニン受容体拮抗作用など様々な生理活性を有する。今回我々はパラジウム触媒によるアレンの連続環化反応を鍵反応とした ergot alkaloid 骨格の合成を計画した。

【実験・結果】 市販の 4-bromoindole から 10 工程で合成した propargyl vinyl ether **2** に対して金触媒による Claisen 転位反応を行うことでアレン **3** へと誘導した。**3** をノシルアミド体 **4** に変換後、パラジウム触媒存在下 100°C で加熱すると、目的の連続環化反応はすみやかに進行し、ergot alkaloid 骨格を有する **6** を一举に収率 80% で得ることに成功した。さらに官能基変換により生理活性天然物である lysergol および isolysergol の全合成を達成した。

