

28TF-am04

Tangutorine の不斉全合成

○根本 哲宏¹, 山本 絵理¹, Robert FRANZEN¹, 福山 尚¹, Riliga WU¹,
深町 利彦¹, 小林 弘¹, 濱田 康正¹(¹千葉大院薬)

【目的】Tangutorine (**1**)は 1999 年に Che らによりラセミ体として単離、構造決定されたβ-カルボリンアルカロイドであり、人結腸がん細胞増殖抑制作用を示すことが知られている。図に示す通り、本化合物は本質的に光学活性化合物であるが、ラセミ体合成が報告されているのみで、不斉全合成は報告されていない。そのため、生物活性がどちらのエナンチオマーに起因するのか明らかになっておらず、この点を明らかにすることを目的として不斉全合成を行った。

【結果】環状アリルカーボネート **2** に対して、Pd-ジアミノホスフィンオキシド (DIAPHOX)触媒系を用いるアリル位アミノ化反応を行うことによりキラルアミン体 **3** を得た後、Sharpless 不斉エポキシ化反応を経由し 1 3 工程にてアミノアセタール体 **4** へと導いた。続く分子内 Pictet-Spengler 反応により望みの立体化学を有する化合物 **5b** を主生成物として得た。本化合物より 9 工程にて **1** の不斉全合成に成功した。本発表では、両エナンチオマーの生物活性についても報告する。

