

30P1-pm003

カイノイドにおける三連続不斉中心の立体選択的構築

○鈴木 寛人¹, 浅川 倫宏¹, 濱島 義隆¹, 菅 敏幸¹ (¹静岡県大薬)

【目的】ドウモイ酸 (**1**) は紅藻ハナヤナギより単離、構造決定されたグルタミン酸受容体部分アゴニストである。近年この受容体の機能解明には大きな関心が寄せられており、**1** は脳神経疾患の研究ツールとして必須の化合物となっている。**1** の合成において、三連続不斉中心を含む高度に官能基化されたピロリジン骨格の立体制御が合成の鍵となる。そこで我々は、ピロリジン骨格の立体選択的構築を目的として、**1** の全合成研究に着手した。

【方法・結果】光学活性な **2** の立体選択的還元によりオレフィン **3** へと導き、有機スズ試薬を用いた 2,3-Wittig 転位によりジアステレオ選択的にアルコール **4** へと変換した。続いて光延反応により窒素原子を導入後、Eschenmoser-Claisen 転位により 3 位の立体を構築し **5** へと導いた。さらにラクトン形成後、オゾン分解と分子内環化に続く Strecker 反応によりワンポットでアミノニトリル **7** へと変換し、ピロリジン環上の三連続不斉中心の構築を達成した。今後は 4 位の側鎖の伸長を行い、**1** の全合成を達成する予定である。

