

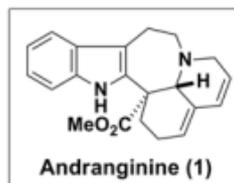
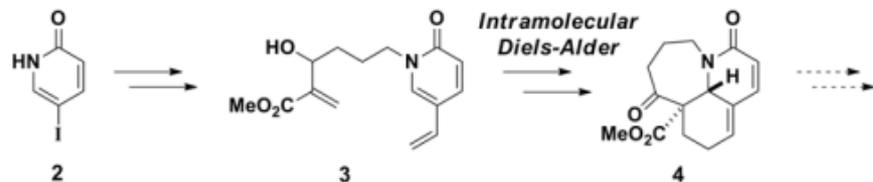
29pmM-007

Kopsia アルカロイド Andranginine の全合成研究

○三森 雄二¹, 玉田 卓矢¹, 小暮 紀行¹, 北島 満里子¹, 高山 廣光¹ (1千葉大院薬)

【目的】我々は中国雲南省に自生するキョウチクトウ科 *Kopsia arborea* Blume の成分探索を行い、Andranginine (**1**) を含む種々のアルカロイドを単離した。**1** はラセミ体での単離報告があるが¹⁾、今回我々が単離した **1** は $[\alpha]_D^{20} = -24.3^{\circ}$ (c 0.1 CHCl₃) の旋光性を示したことから、光学活性体として存在することが明らかとなった。そこで、**1** の絶対立体配置を合成的手法により決定することを目的とし、まずラセミ体の全合成に着手した。

【方法・結果】5-Iodo-2-pyridone (**2**) を原料とし、クロスカップリングを用いて 5 位に Vinyl 基を導入した後、*N*-アルキル化、アルデヒドへの変換、Baylis-Hillman 反応を行い分子内 Diels-Alder 反応前駆体 **3** へと導いた。**3** のアリルアルコールを酸化したところ分子内 Diels-Alder 反応が容易に進行し、目的の相対立体配置を有する三環性化合物 **4** を合成することが出来た。今後、インドール環の構築及びアミドの還元を経て、**1** の全合成を達成する予定である。



1) P. Potier *et al.*, *J. Chem. Soc., Chem. Commun.*, **1974**, 164-165