

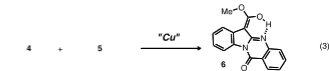
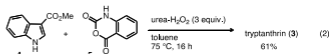
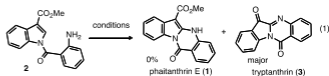
27PB-am008

ラン科植物アルカロイド phaitanthrin E の合成研究

○伊藤 智貴¹, 阿部 匠¹, 石倉 稔¹ (¹北医療大薬)

【目的】2008年、phaitanthrin 類がラン科 *Phaius mishmensis* から単離された¹⁾。これら phaitanthrin 類はインドロキナゾリン骨格を有し、中でも phaitanthrin E (**1**) についてはインドール環を保持している唯一のインドロキナゾリン型天然物である。今日までに **1** については合成例が全くないばかりか、合成研究自体も報告されていない。そこで我々は、**1** の特異な新規骨格に興味を持ち、合成による構造確認と生物活性試験用のサンプル供給のために **1** の全合成研究に着手した。

【方法・結果】まず、アミド **2** を基質として用い分子内 C-H アミノ化反応を検討した (式 1)。予想していた **1** は全く得られず、相当量の原料回収とともに低収率で tryptanthrin (**3**) を得た。種々検討したが、脱炭酸を経由して **3** が得られるのみで **1** は全く得られなかった。続いて、インドール **4** と酸無水物 **5** のタンデム型 Dakin 酸化反応²⁾ を検討したが、先と同様に **3** が得られるのみであった (式 2)。次に、**4** と **5** の反応において銅錯体を用いたところ、縮合/分子内 C-H アミノ化反応が進行しイミン形の **6** がワンポット操作で得られることを見出した (式 3)。現在、本タンデム反応の反応条件精査・基質一般性とともに、エナミン形 **1** への変換も検討中であり併せて報告したい。



1) Jao, C.-W.; Lin, W.-C.; Wu, Y.-T.; Wu, P.-L. *J. Nat. Prod.* **2008**, *71*, 1275-1279.

2) Abe, T.; Itoh, T.; Choshi, T.; Hibino, S.; Ishikura, M. *Tetrahedron Lett.* **2014**, *55*, 5268-3625.