

29K-am02S

Dragmacidin E の合成研究

○井上直也¹, 仲野 駿一¹, 濱田 康正¹, 根本 哲宏¹ (¹千葉大院薬)

【目的】 Dragmacidin E (**1**) は *Spongosortes* 種海綿から単離されたセリン-トレオニンホスファターゼ阻害作用をもつビスインドールアルカロイドである。今回、当研究室で開発した Pd 触媒によるアレンへの分子内 Heck 挿入-求核環化反応¹を鍵段階とする、本化合物の新規合成法の検討を行った。

【方法・結果】 **1** への合成経路確立のため、まずはモデル化合物 **7** の合成を目指した。アレン誘導体 **2** に Pd 触媒を作用

させることで目的の三環性化合物 **3** を 94% 収率にて得た。酸化反応や種々の変換

により得られた **4** を Rh 触媒によるアジリジン化反応の条件に附したところアミノ

アセトキシ化反応が施行し、**5** を 70% 収率にて得た。続く光延反応、オキサゾリ

ジノン環の開裂など更なる変換を行い **6** へと誘導した。現在はピラジノン環構築

の検討を行っている。1) *Org. Lett.*, **2015**, *17*, 2622-2625.

