

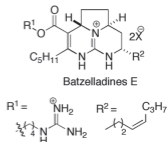
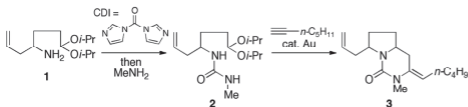
# 25S-am07S

## 金触媒による連続環化反応を鍵とする Batzelladine 類の合成研究

○板垣 大地<sup>1</sup>, 丸茂 和哉<sup>1</sup>, 植田 浩史<sup>1</sup>, 徳山 英利<sup>1</sup> (東北大院薬)

【目的】海産グアニジンアルカロイドは、強力な生物活性を有し、近年注目を集めている。なかでも、三環性グアニジン骨格を有する batzelladine 類は、抗 HIV 活性をはじめとした多様な生物活性を示し、合成化学者の興味を惹きつけてやまない化合物群である。最近、我々は金触媒のオートタンデム触媒機構を用いた、新規ピロール合成法を開発した<sup>1</sup>。そこで、本反応を連続環化反応へと応用することで、batzelladine 類に含まれる pyrrolopyrimidine 骨格の効率的な構築を鍵とする、本化合物群の網羅的合成が行なえると考え、研究に着手した。

【方法・結果】まず、アセタールを有するアミン **1**、CDI とメチルアミンから、鎖状ウレア **2** を収束的に合成した。検討の結果、**2** に対してカチオン性金触媒とアルキンを作用させると、金触媒のオートタンデム触媒機構が円滑に進行し、pyrrolopyrimidine 骨格 **3** を与えることを見出した。さらなる検討により、得られた二環性のウレア **3** は、容易にグアニジンへの変換が可能であることがわかった。現在、batzelladine 類の合成研究を行っている。本発表では、鍵反応となる連続環化反応の推定機構の詳細と、その後の合成研究について報告する。



【参考文献】 1) Tokuyama, H. *et al. Org. Lett.* **2014**, *16*, 4948.