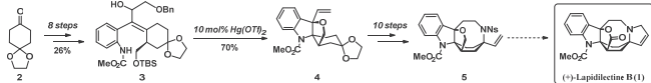


25S-am06S

(+)-Lapidilectine B の全合成研究

○牛山 和輝¹, 石川 雄大², 中山 淳², 須藤 宏城³, 谷野 圭持³, 難波 康祐² (¹徳島大薬, ²徳島大院薬, ³北大院理)

[目的] (+)-Lapidilectine B (**1**)は1992年に Awang らによって *Kopsia Lapidilecta* の樹皮及び葉より単離・構造決定された、モノテルペノイドインドールアルカロイドである。¹⁾ 2つの含窒素四置換炭素を含む複雑な6環性骨格を構造上の特徴としており、ビンクリスチン耐性 KB 細胞に対して薬剤耐性を無効化する生物活性が知られており、²⁾ これまでに2例の全合成例が報告されている。^{3a,b)} 今回我々は、Hg(OTf)₂ 触媒を用いることにより、(+)-Lapidilectine B (**1**) の主要な4環性骨格の一段階構築及び8員環アミンの構築に成功したので報告する。[方法・結果] シクロヘキサノン誘導体 **2** から8工程で環化前駆体となる **3** へと導いた。得られたアリルアルコール体 **3** を10 mol% の Hg(OTf)₂ で処理したところ、目的とする四環性化合物 **4** を70%の収率で与えた。その後、10工程の変換により8員環アミン化合物 **5** の生成を確認した。現在 **5** からの(+)-Lapidilectine B (**1**)への変換を検討中である。



1) Awang, K. *et al. Tetrahedron Lett.* **1992**, 33, 2493.

2) Kam, T. S. *et al. J. Nat. Prod.* **2011**, 74, 1309.

3) (a) Pearson, W. H *et al. J. Am. Chem. Soc.* 2001, 123, 6724.

(b) Nishida, A *et al. angew. chem. Int.* 2016, 55, 3473-3476.