

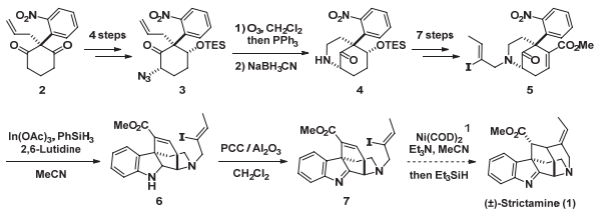
25S-am03S

Akuammiline 型インドールアルカロイド Strictamine の形式全合成

○佐藤 圭悟¹, 高梨 憲幸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】Akuammiline 型インドールアルカロイドは、キョウチクトウ科の植物に含有されている天然物である。中でも、インドレニン環やインドリン環に連結した三環性の籠状骨格を有する化合物は、NF- κ B 阻害活性や抗炎症作用を含む様々な生物活性を示すことが知られている。その活性は籠状骨格の置換基の差異に由来すると考えられており、本アルカロイドは創薬リード分子として魅力的である。本研究では、その効率的な合成法を確立することを目的とし、まず Strictamine (**1**)の全合成研究に着手した。

【方法・結果】文献既知化合物 **2** より 4 工程でアジド **3** を単一ジアステレオマーで得た。オゾン分解、続く Staudinger, Aza-Wittig 反応、イミンの還元によって化合物 **4** を合成した。さらに 7 工程を経てビニルアジド **5** を得た。続いてインジウムを用いたニトロ基の還元によってインドリン **6** を合成し、これを酸化することでインドレニン **7** へ導いた。**7** は論文¹中の合成中間体であり、**1** の形式全合成を達成した。



1) J. Zhu *et al.* *Angew. Chem. Int. Ed.* **2016**, *55*, 3500-3503.