

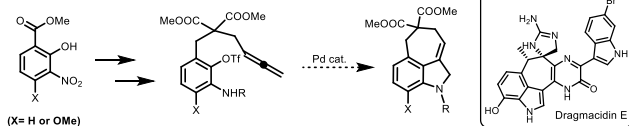
28PA-am007S

ドラグマシジン E の合成研究

○丸岡 花香¹, 崔 東一¹, 井上 直也¹, 仲野 駿一¹, 根本 哲宏¹ (¹千葉大院薬)

【目的】 ドラグマシジン E はセリン-トレオニンホスファターゼ阻害作用を示す天然物であり、3環性のインドール骨格に対して様々なヘテロ環が連なる特徴的な構造を有する。当研究室ではこれまでに、Pd 触媒を用いる Heck 挿入—分子内アリール位アミノ化カスケード¹ を鍵工程とする、ドラグマシジン E の骨格合成法を開発している²。本成果をもとに、インドール上のフェノール基の導入までを含めたドラグマシジン E の 3,4 位 7 員環縮環インドール骨格の合成研究を行った。

【方法・結果】 ドラグマシジン E の合成に必要な 4 置換ヨードベンゼン誘導体は、合成が困難であることが予想された。そこで、3 置換、または 4 置換のアリールトリフレート体を合成し、カスケード環化反応へと適用することとした。既知の合成法により調製可能な下図のニトロフェノール誘導体を原料として、アレルニルマロネート部位と連結しモデル基質を合成した。現在、トリフレート型基質を用いる Pd 触媒によるカスケード環化反応の検討を進めている。



References. (1) Nakano, S. et al. *Org. Lett.* **2015**, *17*, 2622. (2) Inoue, N. et al. *J. Org. Chem.* **2017**, *82*, 2787.