

21PO-am009

チアシクロイソジチロシンの合成研究

○早川 怜旺¹, 深谷 晴彦¹, 一柳 幸生¹ (¹東京薬大薬)

【目的】RA-VII (**1**) はアカネ科 *Rubia* 属植物より単離された抗腫瘍性ペプチド化合物である。Tyr-5、Tyr-6 残基で構成される 14 員環構造のシクロイソジチロシン部位が活性発現に重要と考えられている。**1** の芳香環の配向を修飾したアナログとして、ジフェニルエーテルの酸素原子を硫黄原子で置換した化合物 **2** をデザインした。ここでは **2** の合成に必要なチアシクロイソジチロシンの合成を検討する。

【方法・結果】L-フェニルアラニンと L-チロシンをそれぞれヨウ素化して得た **3** および **4** よりジペプチド **5** と **6** を合成した。これらの化合物について銅およびパラジウム触媒を用いてジフェニルチオエーテル化反応を種々検討した結果、**5** からは低収率 (5.5%) ではあるが環化体 **7** が得られた。**7** の構造は X 線結晶解析により確認した。一方、**6** から環化体 **8** は得られなかった。現在 **5** の閉環収率の改善を検討中である。

