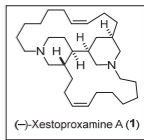


22L-am03S

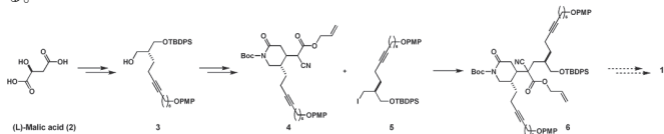
ゼストプロキサミン A の合成研究

○高橋 航¹, 長谷川 寛直¹, 河辺 佑介¹, 大内 仁志¹, 稲井 誠¹, 浅川 倫宏², 吉村 文彦¹, 菅 敏幸¹ (¹静岡県大薬, ²東海大創科技研)

【目的】 シクラミン類は、抗生物質活性や抗真菌活性といった有用な生物活性を有する四環性のビスピペリジンアルカロイドである。共通構造として、2つのマクロ環の中心に3-4位で連結したビスピペリジン骨格を有している。我々は、生物学的、構造的に魅力のある本化合物群に着目し、未だ合成報告のない *trans-syn-cis* 配置のビスピペリジン骨格を有するゼストプロキサミン A (**1**) の合成を目標に研究に着手した¹⁾。



【方法・結果】 4つの不斉中心を有したビスラクトン骨格をビスピペリジン骨格へと変換する合成戦略に従い **1** の合成を目指すこととした。L-リンゴ酸 (**2**) を出発原料に、共通中間体であるアルコール **3** を合成した後、ラクタム **4** 及びヨウ化アルキル **5** を合成した。続いてラクタム **4** とヨウ化アルキル **5** のアルキル化反応を行い、アルキル化体 **6** を得た。今後、全ての不斉中心の構築及びマクロ環の構築、最後にビスピペリジン骨格への変換を経て **1** の全合成を達成する予定である。



1) B. I. Morinaka, T. F. Molinski, *J. Nat. Prod.*, 74, 430 (2011).