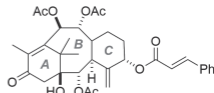


# 22L-am08S

## 1-ヒドロキシタキシニンの全合成

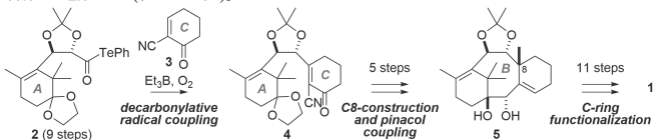
○今村 祐亮<sup>1</sup>, 吉岡 駿<sup>1</sup>, 長友 優典<sup>1</sup>, 井上 将行<sup>1</sup> (<sup>1</sup>東大院薬)

【目的】1-ヒドロキシタキシニン(**1**)は、がん細胞に対して細胞毒性を示す<sup>1)</sup>。**1**は6/8/6員環が特異に縮環したタキサン骨格が6つの酸素官能基で修飾された構造を有する。我々はタキサンジテルペンの統一の合成を目指し、2つのラジカル反応を鍵とする**1**の全合成研究に着手した。



1-hydroxytaxinine (**1**)

【方法・結果】市販化合物から9工程で合成したアシルテルリド**2**に対し、シクロヘキセノン**3**共存下、空気雰囲気下Et<sub>3</sub>Bを作用させると、脱一酸化炭素を伴うラジカル付加反応が進行し、A,C環連結体を立体選択的に与えた<sup>2)</sup>。さらに、ワンポットでの酸化反応でエノン**4**へと導いた。続く、C8位第四級炭素の構築を含む4工程の変換の後、B環形成を伴うピナコールカップリングで立体選択的にジオール**5**を合成した<sup>3)</sup>。その後、**5**からのアリル位酸化を含む11工程の変換で**1**の全合成を達成した(総25工程)。



1) (a) Kobayashi, J. et al. *Tetrahedron* **1994**, *50*, 7401. (b) Kobayashi, J. et al. *Heterocycles* **1998**, *47*, 1111.

2) (a) Inoue, M. et al. *Chem. Sci.* **2015**, *6*, 2765. (b) Inoue, M. et al. *Tetrahedron* **2016**, *72*, 4859.

3) Swindell, C. S. et al. *Tetrahedron Lett.* **1996**, *37*, 2321.