

21PO-am010

カルバシクロイソジチロシンの合成研究

○有田 楓¹, 星 理紗¹, 関根 美香¹, 永井 裕久¹, 正田 遊野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。その芳香環の電子密度が細胞毒性におよぼす影響を検証するため、ジフェニルエーテルの酸素原子をメチレン基で置換したアナログ **2** をデザインした。ここでは化合物 **2** の合成に必要なカルバシクロイソジチロシンの合成を検討する。

【方法・結果】L-tyrosine と L-phenylalanine よりジペプチド **4-6** を合成した。

これらの化合物についてパラジウム触媒を用いて炭素-炭素結合形成反応を種々検討した結果、**4** および **5** からそれぞれ収率 36%、8.2% で環化体 **7** および **8** が得られた。環化体 **8** は X 線結晶解析により構造を確認した。一方、化合物 **6** から環化体 **9** は得られなかった。現在 **4** および **5** の閉環収率の改善を検討中である。

