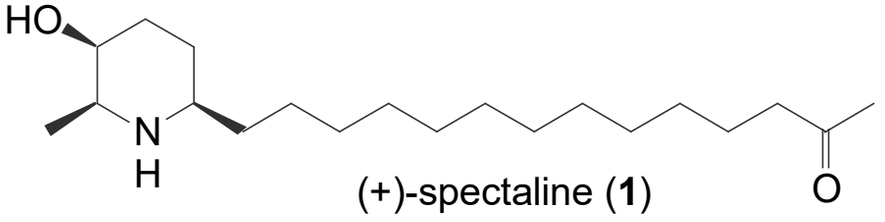
21PO-am003

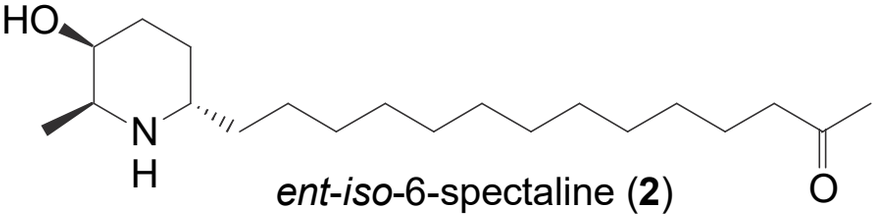
パラジウム触媒による立体選択的環化反応を用いた ent-iso-6-spectaline の合成

○亀田 里紗子[1], 相馬 琢人[1], 古田 善宏[1], 葛山 昌伴[1], 小林 数也[1], 服部 恭尚[2], 赤路 健一[1]（[1]京都薬大・薬品化学，[2]京都薬大・共同機器セ）

【目的】Spectaline と *iso*-6-spectaline は 6 位立体配置のみが異なる天然物で、それぞれについて多様な生物活性が報告されている[a]。1) 我々は既に (+)-spectaline (**1**) の効率的合成に成功しており[b]、2) 本発表では metathesis 反応を利用した *ent-iso*-6-spectaline (**2**) の立体選択的合成について報告する。

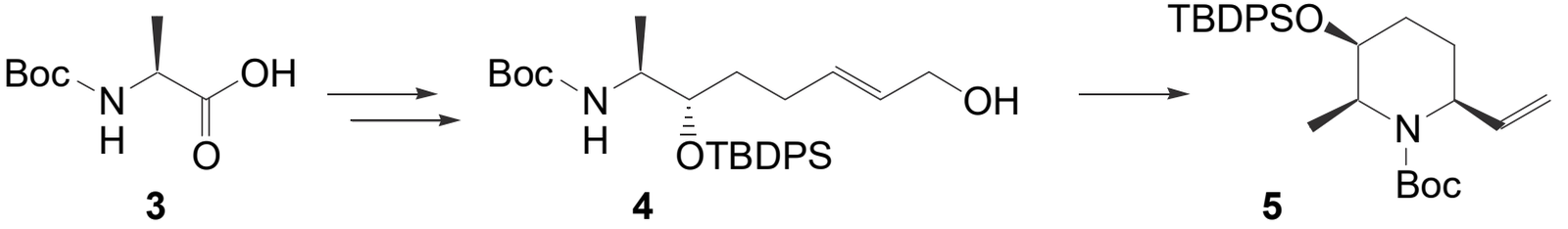


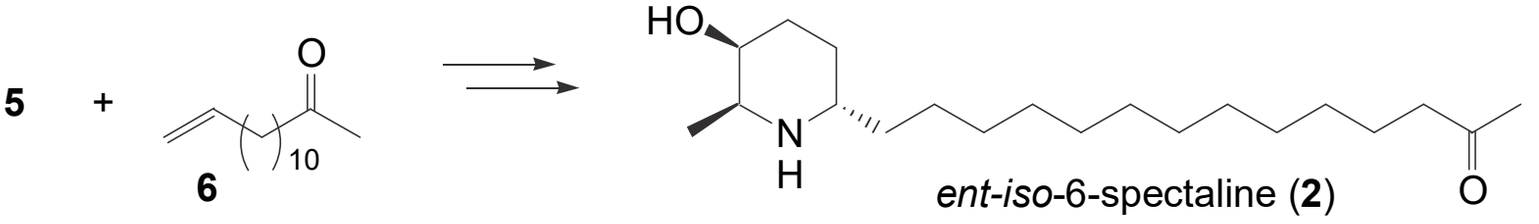
(+)-spectaline (**1**)



ent-iso-6-spectaline (**2**)

【方法と結果】Boc-Ala-OH (**3**) を出発物質として Brown hydroboration や Horner-Wadsworth-Emmons 反応等を経て環化前駆体 **4** を得た。次いで、環化反応によりピペリジン **5** を合成した。さらに、**5** と別途合成した側鎖 **6** との cross-metathesis を行った後、数工程で *ent-iso*-6-spectaline (**2**) の合成を達成した。





ent-iso-6-spectaline (**2**)

a. Viegas Jr., C.; Bolzani, V. S. *et al*. *J. Nat. Prod*. **2004**, *67*, 908-910.
b. Katsuyama, M.; Akaji, K.; Hattori, Y. *et al*. *Heterocycles* **2015**, *91*, 959-969