

21L-am06S

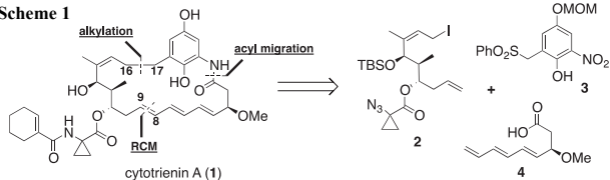
サイトトリエンニン A の全合成研究

○佐藤 晋平¹, 福田 隼², 渡邊 瑞貴¹, 周東 智¹ (¹北大院薬, ²長崎大院医歯薬)

【目的】放線菌 *Streptomyces* RK95-74 より単離・構造決定されたアンサマイシン系天然物サイトトリエンニン A (**1**)¹⁾ は、低濃度で各種培養白血病細胞のアポトーシスを誘導することから新規抗がん剤リード化合物として期待されており、これまでに一例の全合成が報告されている²⁾。我々は、**1** の創薬研究への展開を視野に入れ、より効率的な全合成経路の確立を目指すこととした。

【方法・結果】全合成に向けて、ヨウ化アリル**2**とベンジルスルホン**3**のC16-C17間でのアルキル化により両フラグメントを連結した後、トリエンカルボン酸**4**との縮合、C8-C9間でのRCMと続く分子内アシル転移/環拡大反応によるマクロラクタム骨格構築を鍵工程とする合成経路を立案した (Scheme 1)。モデル基質でのマクロラクタム骨格構築に成功し、全フラグメントの合成を完了した。現在は、全合成に向けた変換を検討している。

Scheme 1



cytotrienin A (**1**)

1) Osada, H. *et al. Tetrahedron Lett.* **1997**, *38*, 1789.

2) Hayashi, Y. *et al. Angew. Chem. Int. Ed.* **2008**, *47*, 6657.