

21L-am01S

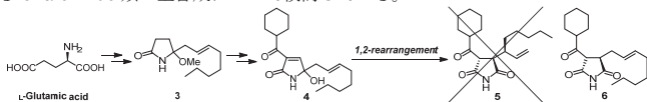
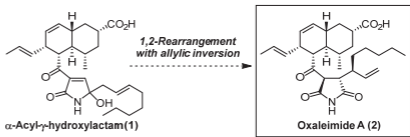
抗腫瘍活性物質 Oxaleimide 類の全合成研究

○田辺 悠記¹, 坪郷 哲^{1,2}, 内呂 拓実^{1,2} (¹東京理大薬, ²東京理大戦略的物理製剤学研セ)

【背景・目的】 Oxaleimide 類は2017年に Tang らのグループによって真菌 *Penicillium oxalicum* より見出された抗腫瘍性物質である¹⁾。本化合物群の生合成経路について

は、 α -アシル- γ -ヒドロキシラクタム型前駆体 (1) のラクタム環上の γ 位置換基がアリル反転を伴う 1,2-転位反応を起こすことにより、Oxaleimide A (2) を生じた後、他の類縁体を与えたものと推定されている。そこで演者らは、Oxaleimide 類の全合成研究を通じて、上述の 1,2-転位反応に関する検証を試みることにした。

【方法・結果】 まず、L-グルタミン酸から γ -メトキシラクタム **3** を得た。さらに Claisen 縮合反応によるアシル基の導入、 α - β 位間の不飽和化と脱保護を経て、望みのモデル基質 **4** を合成することができた。そこで、塩基性条件下で **4** に対する 1,2-転位反応を試みたところ、アリル反転を伴わない転位成績体 **6** のみが生じることが明らかとなった。そこで現在、上述の推定生合成経路によらない方法による Oxaleimide 類の全合成について検討している。



1) Tang, Y. *et al.*, *J. Am. Chem. Soc.* **2017**, *139*, 5317-5320.